



<b>(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :</b> <b>C07C 311/51, C07D 213/81, A01N 37/28, 43/40</b>	<b>A1</b>	<b>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/16744</b>  <b>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:</b> 8. April 1999 (08.04.99)
<b>(21) Internationales Aktenzeichen:</b> PCT/EP98/06097  <b>(22) Internationales Anmeldedatum:</b> 24. September 1998 (24.09.98)  <b>(30) Prioritätsdaten:</b> 197 42 951.3      29. September 1997 (29.09.97)    DE  <b>(71) Anmelder:</b> HOECHST SCHERING AGREVO GMBH [DE/DE]; Mirastrasse 54, D-13509 Berlin (DE).  <b>(72) Erfinder:</b> ZIEMER, Frank; Uhlandstrasse 2, D-65830 Kriftel (DE). WILLMS, Lothar; Königsteiner Strasse 50, D-65719 Hofheim (DE). AULER, Thomas; Kastanienweg 7, D-65451 Kelsterbach (DE). BIERINGER, Hermann; Eichenweg 26, D-65817 Eppstein (DE). ROSINGER, Christopher; Am Hochfeld 33, D-65719 Hofheim (DE).		<b>(81) Bestimmungsstaaten:</b> AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CU, CZ, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UZ, VN, YU, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).  <b>Veröffentlicht</b> <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i> <i>Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>
<b>(54) Title:</b> ACYLSULFAMOYL BENZOIC ACID AMIDES, PLANT PROTECTION AGENTS CONTAINING SAID ACYLSULFAMOYL BENZOIC ACID AMIDES, AND METHOD FOR PRODUCING THE SAME		
<b>(54) Bezeichnung:</b> ACYLSULFAMOYLBENZOESÄUREAMIDE, DIESE ENTHALTENDE NUTZPFLANZENSCHÜTZENDE MITTEL UND VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG		
<div style="text-align: center;"> </div> <div style="text-align: right; margin-top: -40px;">(I)</div>		
<b>(57) Abstract</b>  The invention relates to acylsulfamoyl benzoic acid amides of general formula (I), wherein R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> and R <sup>5</sup> represent various organic radicals and X represents CH or N, and to plant protection agents containing said acylsulfamoyl benzoic acid amides.  <b>(57) Zusammenfassung</b>  Es werden Acylsulfamoylbenzoesäureamide der allgemeinen Formel (I) und sie enthaltende nutzpflanzenschützende Mittel beschrieben. In dieser allgemeinen Formel (I) stehen R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> , R <sup>4</sup> und R <sup>5</sup> für verschiedene organische Reste und X steht für CH oder N.		

### **LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidshon	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

Acylsulfamoylbenzoesäureamide, diese enthaltende nutzpflanzenschützende Mittel und Verfahren zu ihrer Herstellung

Die vorliegende Erfindung betrifft nutzpflanzenschützende Mittel, die Acylsulfamoylbenzoesäureamide und gegebenenfalls Pestizide enthalten, sowie bestimmte Acylsulfamoylbenzoesäureamide und Verfahren zu ihrer Herstellung.

Bei der Bekämpfung unerwünschter Organismen in land- und forstwirtschaftlichen Nutzpflanzenkulturen mit Pestiziden werden - in an sich unerwünschter Weise - häufig auch die Nutzpflanzen durch die verwendeten Pestizide mehr oder weniger stark geschädigt. Dieser Effekt tritt in besonderem Maße bei der Verwendung von zahlreichen Herbiziden - und dort in erster Linie bei der sogenannten Nachauflapplikation - in Nutzpflanzenkulturen wie Mais, Reis oder Getreide auf. Durch den Einsatz sogenannter "Safener" oder "Antidots" können in manchen Fällen die Nutzpflanzen gegen die phytotoxischen Eigenschaften der Pestizide geschützt werden, ohne daß die pestizide Wirkung gegenüber den Schadorganismen geschmälert wird.

Die bislang als Safener bekannt gewordenen Verbindungen weisen unterschiedliche chemische Strukturen auf. So sind aus US-A 4,902,340 Derivate von Chinolin-8-oxy-alkancarbonsäuren als Safener für Herbizide aus der Reihe der Diphenylether und der Pyridyloxyphenoxypropionsäuren und aus EP-A 0 520 371 Isoxazoline sowie Isothiazoline als Safener für verschiedene Arten von Herbiziden bekannt, wobei in der letztgenannten Veröffentlichung Aryloxyphenoxycarbonsäuren, Sulfonylharnstoffe und Imidazolinone als bevorzugte Herbizide genannt sind.

Imai et al. beschreiben in *Nippon Kagaku Kaishi*, **1975**, 123-126, (*Chem. Abstr.*, (1976), **84**: 17204) drei Acylsulfamoylbenzoesäureamide, speziell die Verbindungen

- 2-(Benzoylsulfamoyl)-N-phenylbenzamid
- 2-(Benzoylsulfamoyl)-N-benzylbenzamid
- 4-(2-Benzoylsulfamoyl-benzoylamino)-benzoesäure.

Eine besondere biologische Wirkung oder andere Eigenschaften dieser Verbindungen sind nicht genannt.

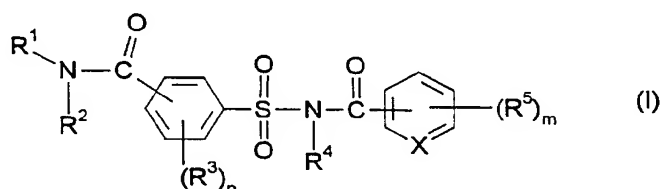
In EP-A 0 562 512 werden Acylsulfamoylbenzoesäureamide beschrieben, die in 2- bzw. in 6-Position des Pyridinrings eine Aminocarbonylgruppe tragen. Aus EP-A 0 590 520 sind Acylsulfamoylbenzoesäureamide bekannt, die in 2- bzw. in 6-Position des Pyridinrings gegebenenfalls durch eine Estergruppe substituiert sind. EP-A 0 673 932 nennt Acylsulfamoylbenzoesäureamide, die in 2- und 4-Position des Pyridinrings jeweils eine Aminocarbonylgruppe tragen. Die in diesen drei Veröffentlichungen genannten Acylsulfamoylbenzoesäureamide werden als Arzneimittel gegen fibrotische Erkrankungen beschrieben. Eine Safener-Wirkung von Acylsulf-amoylbenzoesäureamiden ist bislang nicht bekannt.

Bei der Anwendung von Safenern zum Schutz der Nutzpflanzen vor den Pestizidschädigungen hat sich gezeigt, daß die bekannten Safener in vielen Fällen immer noch gewisse Nachteile aufweisen können. Dazu zählen:

- der Safener vermindert die Wirkung der Pestizide, insbesondere die von Herbiziden, gegen die Schadpflanzen
- die nutzpflanzenschützenden Eigenschaften sind nicht ausreichend
- in Kombination mit einem gegebenen Herbizid ist das Spektrum der Nutzpflanzen, in denen der Safener/Herbizid-Einsatz erfolgen soll, nicht ausreichend groß
- ein gegebener Safener ist nicht mit einer ausreichend großen Anzahl von Herbiziden kombinierbar.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist die Bereitstellung nutzpflanzenschützender Mittel, die Verbindungen mit verbesserter Safener-Wirkung und gegebenenfalls Pestizide enthalten.

Die Lösung der Aufgabe sind gegebenenfalls mindestens ein Pestizid enthaltende nutzpflanzenschützende Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt mindestens eines Acylsulfamoylbenzoesäureamids der allgemeinen Formel I, gegebenenfalls auch in seiner Salzform,



in der

X CH oder N;

R¹ Wasserstoff, Heterocyclyl oder einen Kohlenwasserstoffrest, wobei die beiden letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO, CONH₂, SO₂NH₂ und Z<sup>a</sup>-R<sup>a</sup> substituiert sind;

R² Wasserstoff, Hydroxy, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₂-C₆)-Alkenyloxy, wobei die fünf letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy und (C₁-C₄)-Alkylthio substituiert sind, oder

R¹ und R² zusammen mit dem sie tragenden Stickstoffatom einen 3- bis 8-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bildend;

R³ Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO, CONH₂, SO₂NH₂ oder Z<sup>b</sup>-R<sup>b</sup>;

R⁴ Wasserstoff, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₂-C₄)-Alkenyl oder (C₂-C₄)-Alkynyl;

$R^5$  Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, Phosphoryl, CHO, CONH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> oder  $Z^c-R^c$ ;

$R^a$  einen (C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, Heterocyclyl oder einen Kohlenwasserstoffrest, wobei die zwei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Mono- und Di-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl]-amino substituiert sind;

$R^b$ ,  $R^c$  unabhängig voneinander einen (C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, Heterocyclyl oder einen Kohlenwasserstoffrest, wobei die zwei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Phosphoryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkoxy, Mono- und Di-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl]-amino substituiert sind;

$Z^a$  eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup>, C(O)NR<sup>d</sup> oder SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup>;

$Z^b$ ,  $Z^c$  unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup> oder C(O)NR<sup>d</sup>;

$R^d$  Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl;

$n$  eine ganze Zahl von 0 bis 4

und

$m$  für den Fall, daß X für CH steht, eine ganze Zahl von 0 bis 5, und für den Fall, daß X für N steht, eine ganze Zahl von 0 bis 4

bedeuten.

Die vorstehend und weiter unter verwendeten Bezeichnungen haben die im folgenden erläuterten Bedeutungen:

Die Bezeichnung "Halogen" umfaßt Fluor, Chlor, Brom und Jod.

Unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" ist ein unverzweigter oder verzweigter Kohlenwasserstoffrest mit 1, 2, 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, z.B. der Methyl-, Ethyl-,

Propyl-, Isopropyl-, 1-Butyl-, 2-Butyl-, 2-Methylpropyl- oder tert.-Butylrest zu verstehen. Entsprechend ist unter Alkylresten mit einem größeren Bereich an Kohlenstoffatomen ein unverzweigter oder verzweigter gesättigter Kohlenwasserstoffrest zu verstehen, der eine Anzahl an Kohlenstoffatomen enthält, die dieser Bereichsangabe entspricht. Der Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl" umfaßt demnach die vorgenannten Alkylreste, sowie z.B. den Pentyl-, 2-Methylbutyl-, 1,1-Dimethylpropyl- und Hexyl-Rest.

Ist die Kohlenstoffkette eines Alkylrests mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen, so bedeutet dies, daß zwei Sauerstoffatome niemals direkt benachbart sein sollen.

Unter "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl" ist eine unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" genannte Alkylgruppe zu verstehen, in der eines oder mehrere Wasserstoffatome durch die entsprechende Anzahl gleicher oder verschiedener Halogenatome, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sind, wie die Trifluormethyl-, die 1-Fluorethyl-, die 2,2,2-Trifluorethyl-, die Chlormethyl-, Fluormethyl-, die Difluormethyl- und die 1,1,2,2-Tetrafluorethylgruppe.

Unter "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy" ist eine Alkoxygruppe zu verstehen, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat. Sinngemäß sind auch solche Alkoxygruppen zu verstehen, die einen größeren Bereich an Kohlenstoffatomen umfassen.

Die Bezeichnungen "Alkenyl" und "Alkinyl" mit einer vorangestellten Bereichsangabe von Kohlenstoffatomen bedeuten einen geradkettigen oder verzweigten Kohlenwasserstoffrest mit einer dieser Bereichsangabe entsprechenden Kohlenstoff-atomzahl, wobei dieser Kohlenwasserstoffrest mindestens eine Mehrfachbindung beinhaltet, und sich diese an beliebiger Position des betreffenden ungesättigten Restes befinden kann. "(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl" steht demnach z.B. für die Vinyl-, Allyl-, 2-Methyl-2-propenyl-, 2-Butenyl-, Pentenyl-, 2-Methylpentenyl- oder die Hexenyl-Gruppe. "(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl" steht z.B. für die Ethinyl-, Propargyl-, 2-Methyl-2-propinyl-, 2-Butinyl-, 2-Pentinyl- und die 2-Hexinyl-Gruppe.

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl" steht für monocyclische Alkylreste, wie den Cyclopropyl-, Cyclobutyl-, Cyclopentyl-, Cyclohexyl-, Cycloheptyl- oder Cyclooctylrest und für bicyclische Alkylreste, wie den Norbornylrest.

Unter "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkoxy" oder "(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylthio" ist einer der oben angeführten (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-Reste, der über ein Sauerstoff- oder Schwefelatom verknüpft ist, zu verstehen.

"(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio" steht für eine Alkylthiogruppe, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat. Analog bedeuten "(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylsulfinyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfinyl-Gruppe und "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- und tert.-Butylsulfonyl-Gruppe.

"Mono- und Di-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl]-amino" steht für ein Stickstoffatom, das durch ein oder zwei, gleiche oder verschiedene Alkylreste der obigen Definition substituiert ist. Analog oben stehender Definitionen sind sinngemäß andere zusammengesetzte Bezeichnungen, wie (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkenyl und [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(Alkylthio)]-carbonyl zu verstehen.

Unter dem Ausdruck "Aryl" ist ein isocyclischer, mono-, bi- oder polycyclischer aromatischer Rest mit vorzugsweise 6 bis 14, insbesondere 6 bis 12 C-Atomen, wie Phenyl, Naphthyl oder Biphenyl, vorzugsweise Phenyl zu verstehen.

Der Ausdruck "Heterocyclyl" steht für einen mono- oder bicyclischen Rest, der vollständig gesättigt, teilweise oder vollständig ungesättigt ist und der ein bis fünf gleiche oder verschiedene Atome aus der Gruppe Stickstoff, Schwefel und Sauerstoff enthält, wobei jedoch nicht zwei Sauerstoffatome direkt benachbart sein dürfen und noch mindestens ein Kohlenstoffatom im Ring vorhanden sein muß, z.B. ein Rest von Thiophen, Furan, Pyrrol, Thiazol, Oxazol, Imidazol, Isothiazol, Isoxazol, Pyrazol, 1,3,4-Oxadiazol, 1,3,4-Thiadiazol, 1,3,4-Triazol, 1,2,4-Oxadiazol, 1,2,4-Thiadiazol, 1,2,4-Triazol, 1,2,3-Triazol, 1,2,3,4-Tetrazol, Benzo[b]thiophen,



Benzo[b]furan, Indol, Benzo[c]thiophen, Benzo[c]furan, Isoindol, Benzoxazol, Benzothiazol, Benzimidazol, Benzisoxazol, Benzisothiazol, Benzopyrazol, Benzothiadiazol, Benzotriazol, Dibenzofuran, Dibenzothiophen, Carbazol, Pyridin, Pyrazin, Pyrimidin, Pyridazin, 1,3,5-Triazin, 1,2,4-Triazin, 1,2,4,5-Tetrazin, Chinolin, Isochinolin, Chinoxalin, Chinazolin, Cinnolin, 1,8-Naphthyridin, 1,5-Naphthyridin, 1,6-Naphthyridin, 1,7-Naphthyridin, Phthalazin, Pyridopyrimidin, Purin, Pteridin, Piperidin, Pyrrolidin, Oxazolin, Tetrahydrofuran, Tetrahydropyran, Isoxazolidin oder Thiazolidin.

Ein "Kohlenwasserstoffrest" ist ein geradkettiger, verzweigter oder cyclischer Kohlenwasserstoffrest, der gesättigt, teilgesättigt, ungesättigt oder aromatisch sein kann, z.B. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl und Aryl, vorzugsweise Alkyl, Alkenyl und Alkynyl mit bis zu 20 C-Atomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Ringatomen oder Phenyl.

In den Fällen, in denen zwei oder mehrere Reste  $R^3$  und/oder  $R^5$  an einem Benzol- oder Pyridinring auftreten, d. h. wenn m und/oder n größer eins sind, können diese Reste jeweils gleich oder verschieden sein.

Bedeutet  $R^1$  in der allgemeinen Formel I einen Kohlenwasserstoffrest, so hat dieser vorzugsweise bis zu 20 Kohlenstoffatome. Trägt dieser Kohlenwasserstoffrest noch weitere kohlenstoffhaltige Substituenten, so ist die Gesamtzahl aller Kohlenstoffatome dieses Rests  $R^1$  vorzugsweise 2 bis 30.

Für den Fall daß  $Z^a$ ,  $Z^b$  und/oder  $Z^c$  eine divalente Einheit bedeuten, die unsymmetrisch ist, d.h. daß sie zwei Möglichkeiten der Verknüpfung erlaubt, sind jeweils beide Möglichkeiten der Verknüpfung von  $Z^a$ ,  $Z^b$ ,  $Z^c$  mit  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  einerseits und dem Rest des Moleküls andererseits durch die allgemeine Formel I umfaßt.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel I können je nach Art und Verknüpfung der Substituenten als Stereoisomere vorliegen. Sind beispielsweise eine oder mehrere Alkenylgruppen vorhanden, so können Diastereomere auftreten. Sind beispielsweise ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome vorhanden, so können Enantiomere und Diastereomere auftreten. Stereoisomere lassen sich aus

den bei der Herstellung anfallenden Gemischen nach üblichen Trennmethoden, beispielsweise durch chromatographische Trennverfahren, erhalten. Ebenso können Stereoisomere durch Einsatz stereoselektiver Reaktionen unter Verwendung optisch aktiver Ausgangs- und/oder Hilfsstoffe selektiv hergestellt werden. Die Erfindung betrifft somit auch alle Stereoisomeren und deren Gemische, die von der allgemeinen Formel I umfaßt, jedoch nicht spezifisch definiert sind. Die Kombinationsmöglichkeiten der verschiedenen Substituenten der allgemeinen Formel I sind so zu verstehen, daß die allgemeinen Grundsätze des Aufbaus chemischer Verbindungen zu beachten sind, d.h. daß nicht Verbindungen gebildet werden sollen, von denen der Fachmann weiß, daß sie chemisch instabil oder nicht möglich sind.

Die Verbindungen der Formel I können Salze bilden. Salzbildung kann durch Einwirkung einer Base auf solche Verbindungen der Formel I erfolgen, die ein acides Wasserstoffatom tragen, z.B. im Falle von  $R^4 = H$  oder  $R^5 = COOH$ .

Geeignete Basen sind beispielsweise organische Amine sowie Ammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, -carbonate und -hydrogencarbonate, insbesondere Natrium- und Kaliumhydroxid, -carbonat und -hydrogencarbonat. Ebenso kann Salzbildung durch Anlagerung einer Säure an basische Gruppen, wie Amino und Alkylamino, erfolgen. Geeignete Säuren hierfür sind anorganische und organische Säuren, beispielsweise HCl, HBr,  $H_2SO_4$ ,  $HNO_3$  und Essigsäure.

In den nutzpflanzenschützenden Mitteln sind solche Verbindungen der allgemeinen Formel I von näherem Interesse, in der

$R^1$  Wasserstoff, 3- bis 8-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel,  $(C_1-C_{12})$ -Alkyl,  $(C_2-C_8)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_8)$ -Alkynyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkenyl oder Aryl, wobei die sieben letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO,  $CONH_2$ ,  $SO_2NH_2$  und  $Z^a-R^a$  substituiert sind;

$R^5$  Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO, CONH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> oder  $Z^c$ - $R^c$ ;

$R^a$  einen (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sieben letztgenannten Reste unabhängig voneinander gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Mono- und Di-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl]-amino substituiert sind;

$R^b$ ,  $R^c$  unabhängig voneinander einen (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei die sieben letztgenannten Reste unabhängig voneinander gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Phosphoryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkoxy, Mono- und Di-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl]-amino substituiert sind;

$Z^a$  eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup> oder C(O)NR<sup>d</sup>;

$Z^b$ ,  $Z^c$  unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup> oder C(O)NR<sup>d</sup> und

$R^d$  Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl bedeuten.

Von besonderem Interesse sind in den nutzpflanzenschützenden Mitteln solche Verbindungen der allgemeinen Formel I, in der

$R^1$  Wasserstoff,  $(C_1-C_8)$ -Alkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkynyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sieben letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, Cyano,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy,  $(C_1-C_6)$ -Alkylthio,  $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfonyl,  $(C_2-C_4)$ -Alkenyloxy,  $(C_2-C_4)$ -Alkenylthio,  $(C_2-C_4)$ -Alkinyloxy,  $(C_2-C_4)$ -Alkynylthio,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkoxy,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyloxy, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ -alkyl]-amino,  $[(C_1-C_6)$ -Alkoxy]-carbonyl,  $[(C_1-C_6)$ -Alkylthio]-carbonyl,  $[(C_1-C_6)$ -Alkyl]-carbonyl, Phenyl, Phenyl- $(C_1-C_4)$ -alkoxy, 5- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel und im Falle cyclischer Reste auch  $(C_1-C_4)$ -Alkyl substituiert sind, wobei die zwanzig letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen und Cyano und im Falle cyclischer Reste auch  $(C_1-C_4)$ -Alkyl substituiert sind;

$R^3$ ,  $R^5$  unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Amino, Hydroxy, Cyano,  $SO_2NH_2$ ,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkynyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyloxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyloxy, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ -Alkyl]-aminosulfonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylthio,  $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy-carbonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylthio-carbonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl-carbonyl, wobei die fünfzehn letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen,  $(C_1-C_4)$ -Haloalkoxy, Cyano,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy und im Falle cyclischer Reste auch  $(C_1-C_4)$ -Alkyl und  $(C_1-C_4)$ -Haloalkyl substituiert sind, bedeuten.

In den nutzpflanzenschützenden Mitteln sind solche Verbindungen der allgemeinen Formel I bevorzugt, in der

X CH<sub>3</sub>;

$R^1$  Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sechs

letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylcarbonyl und Phenyl und im Falle cyclischer Reste auch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl substituiert sind;

R<sup>2</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, wobei die drei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio substituiert sind;

R<sup>3</sup> Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkoxy, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxycarbonyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylcarbonyl;

R<sup>4</sup> Wasserstoff;

R<sup>5</sup> Halogen, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, Phenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxycarbonyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylcarbonyl;

n 0, 1 oder 2 und

m 1 oder 2

bedeuten.

Besonders bevorzugt sind in den nutzpflanzenschützenden Mitteln solche Verbindungen der allgemeinen Formel I, in der

R<sup>1</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, wobei die zwei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl substituiert sind, bedeutet.

In den nutzpflanzenschützenden Mitteln sind solche Verbindungen der allgemeinen Formel I ganz besonders bevorzugt, in der sich die Sulfamoylgruppe in 4-Position des Phenylringes befindet.

Die erfindungsgemäßen Mittel können mindestens ein Pestizid enthalten. Als Pestizide kommen beispielsweise Herbizide, Insektizide, Fungizide, Akarizide und Nematizide, welche jeweils bei alleiniger Anwendung phytotoxische Schäden an den Kulturpflanzen ergeben würden oder bei denen eine Schädigung wahrscheinlich wäre, in Frage. Von besonderem Interesse sind entsprechende pestizide Wirkstoffe aus den Gruppen der Herbizide und Insektizide, insbesondere Herbizide.

Bevorzugt sind nutzpflanzenschützende Mittel enthaltend mindestens ein Herbizid und mindestens eine Verbindung der allgemeinen Formel I.

Für den Fall, daß die erfindungsgemäßen Mittel Pestizide enthalten, werden diese Mittel nach entsprechender Verdünnung entweder direkt auf die Anbaufläche, auf die bereits gekeimten Schad- und/oder Nutzpflanzen oder auf die bereits aufgelaufenen Schad- und/oder Nutzpflanzen appliziert. Für den Fall, daß die erfindungsgemäßen Mittel kein Pestizid enthalten, können diese Mittel

- im sogenannten Tankmix-Verfahren - d.h. unmittelbar vor dem Aufbringen auf die zu behandelnde Fläche erfolgt beim Anwender die Vermischung und Verdünnung der separat käuflichen Produkte nutzpflanzenschützendes Mittel und Pestizid -, oder
- zeitlich vor der Anwendung eines Pestizids, oder
- zeitlich nach der Anwendung eines Pestizids, oder
- zur Saatgut-Vorbehandlung, d.h. zur Beizung des Nutzpflanzensaatguts verwendet werden.

Bevorzugt ist die gemeinsame Anwendung von Safener und Pestizid, insbesondere die von Safener und Herbizid als Fertigformulierung oder die Anwendung im Tankmix-Verfahren.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I können zur gemeinsamen Anwendung mit Pestiziden gleichzeitig oder in beliebiger Reihenfolge mit den Wirkstoffen ausgebracht werden und sind dann in der Lage, schädliche Nebenwirkungen dieser Wirkstoffe bei Kulturpflanzen zu reduzieren oder völlig aufzuheben, ohne die Wirksamkeit dieser Wirkstoffe gegen unerwünschte Schadorganismen zu beeinträchtigen. Dabei können auch Schädigungen, welche durch die Anwendung mehrerer Pestizide entstehen, z.B. durch mehrere Herbizide oder durch Herbizide in Kombination mit Insektiziden oder Fungiziden, wesentlich reduziert oder völlig aufgehoben werden. Hierdurch kann das Einsatzgebiet herkömmlicher Pestizide ganz erheblich erweitert werden.

Insektizide, die allein oder gemeinsam mit Herbiziden Pflanzenschädigungen verursachen können, sind beispielsweise folgende:

Organophosphate z.B. Terbufos (Counter<sup>®</sup>), Fonofos (Dyfonate<sup>®</sup>), Phorate (Thimet<sup>®</sup>), Chlorpyrifos (Reldan<sup>®</sup>), Carbamate, wie Carbofuran (Furadan<sup>®</sup>), Pyrethroid-Insektizide, wie Tefluthrin (Force<sup>®</sup>), Deltamethrin (Decis<sup>®</sup>) und Tralomethrin (Scout<sup>®</sup>) sowie andere insektizide Mittel mit andersartigem Wirkmechanismus.

Herbizide, deren phytotoxische Nebenwirkungen auf Kulturpflanzen mittels Verbindungen der Formel I herabgesetzt werden können, sind z.B. Herbizide aus der Gruppe der Carbamate, Thiocarbamate, Halogenacetanilide, substituierte Phenoxy-, Naphthoxy- und Phenoxyphenoxy-carbonsäure-Derivate sowie Heteroaryloxy-phenoxyalkancarbonsäure-Derivate, wie Chinolyloxy-, Chinoxalyl-oxy-, Pyridyloxy-, Benzoxazolyloxy- und Benzthiazolyloxyphenoxyalkan-carbonsäureester, Cyclo-hexandionabkömmlinge, Imidazolinone, Pyrimidinyloxy-pyridincarbonsäure-Derivate, Pyrimidyloxy-benzoesäure-Derivate, Sulfonylharnstoffe, Triazolo-pyrimidin-sulfonamid-Derivate sowie S-(N-Aryl-N-alkylcarbamoylmethyl)-dithiophosphorsäureester. Bevorzugt sind dabei Phenoxyphenoxy- und Heteroaryloxyphenoxy-carbonsäureester und -salze,

Sulfonylharnstoffe, Imidazolinone sowie Herbizide, die gemeinsam mit ALS-Hemmstoffen (Acetolactat-Synthetase-Hemmstoffe) zur Erweiterung des Wirkungsspektrums eingesetzt werden, z.B. Bentazon, Cyanazin, Atrazin, Bromoxynil, Dicamba und andere Blattherbizide.

Geeignete Herbizide, die mit den erfindungsgemäßen Safenern kombiniert werden können, sind beispielsweise:

A) Herbizide vom Typ der Phenoxyphenoxy- und Heteroaryloxyphenoxycarbonsäure-Derivate, wie

A1) Phenoxyphenoxy- und Benzyloxyphenoxy-carbonsäure-Derivate, z.B. 2-(4-(2,4-Dichlorphenoxy)-phenoxy)-propionsäuremethylester (Diclofop-methyl), 2-(4-(4-Brom-2-chlorphenoxy)phenoxy)propionsäuremethylester (DE-A 26 01 548), 2-(4-(4-Brom-2-fluorphenoxy)phenoxy)propionsäuremethylester (US-A 4,808,750), 2-(4-(2-Chlor-4-trifluormethylphenoxy)phenoxy)propionsäuremethylester (DE-A 24 33 067), 2-(4-(2-Fluor-4-trifluormethylphenoxy)phenoxy)propionsäuremethylester (US-A 4,808,750), 2-(4-(2,4-Dichlorbenzyl)phenoxy)propionsäuremethylester (DE-A 24 17 487), 4-(4-(4-Trifluormethylphenoxy)phenoxy)pent-2-en-säureethylester, 2-(4-(4-Trifluormethylphenoxy)phenoxy)propionsäuremethylester (DE-A 24 33 067);

A2) "Einkernige" Heteroaryloxyphenoxy-alkancarbonsäure-Derivate, z.B. 2-(4-(3,5-Dichlorpyridyl-2-oxy)phenoxy)propionsäureethylester (EP-A 0 002 925), 2-(4-(3,5-Dichlorpyridyl-2-oxy)phenoxy)propionsäurepropargylester (EP-A 0 003 114), 2-(4-(3-Chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyloxy)phenoxy)propionsäure-methylester (EP-A 0 003 890), 2-(4-(3-Chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyloxy)phenoxy)propionsäureethylester (EP-A 0 003 890), 2-(4-(5-Chlor-3-fluor-2-pyridyloxy)phenoxy)propionsäurepropargylester (EP-A 0 191 736),



2-(4-(5-Trifluormethyl-2-pyridyloxy)phenoxy)propionsäurebutylester  
(Fluazifop-butyl);

A3) "Zweikernige" Heteroaryloxyphenoxy-alkancarbonsäure-Derivate, z.B.  
2-(4-(6-Chlor-2-chinoxalyloxy)phenoxy)propionsäuremethylester und -ethylester  
(Quizalofopmethyl und Quizalofopethyl),  
2-(4-(6-Fluor-2-chinoxalyloxy)phenoxy)propionsäuremethylester (s. J. Pest. Sci. Vol.  
10, 61 (1985)),  
2-(4-(6-Chlor-2-chinoxalyloxy)phenoxy)propionsäure-2-isopropylidenaminoxy-  
ethylester (Propaquizafop),  
2-(4-(6-Chlorbenzoxazol-2-yl-oxy)phenoxy)propionsäureethylester (Fenoxaprop-  
ethyl), dessen D(+) Isomer (Fenoxaprop-P-ethyl) und 2-(4-(6-Chlorbenzthiazol-2-  
yloxy)phenoxy)propionsäureethylester (DE-A 26 40 730),  
2-(4-(6-Chlorchinoxalyloxy)phenoxy)propionsäure-tetrahydro-2-furylmethylester  
(EP-A 0 323 727);

B) Herbizide aus der Reihe der Sulfonylharnstoffe, wie Pyrimidin- oder  
Triazinylaminocarbonyl-[benzol-, pyridin-, pyrazol-, thiophen- und (alkylsulfonyl)-  
alkylamino-]-sulfamide. Bevorzugt als Substituenten am Pyrimidinring oder  
Triazinring sind Alkoxy, Alkyl, Haloalkoxy, Haloalkyl, Halogen oder Dimethylamino,  
wobei alle Substituenten unabhängig voneinander kombinierbar sind. Bevorzugte  
Substituenten im Benzol-, Pyridin-, Pyrazol-, Thiophen- oder (Alkylsulfonyl)-  
alkylamino-Teil sind Alkyl, Alkoxy, Halogen, Nitro, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl,  
Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkoxyaminocarbonyl, Halogenalkoxy,  
Halogenalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxyalkyl, (Alkansulfonyl)alkylamino. Solche  
geeignete Sulfonylharnstoffe sind beispielsweise

B1) Phenyl- und Benzylsulfonylharnstoffe und verwandte Verbindungen, z.B.  
1-(2-Chlorphenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)harnstoff  
(Chlorsulfuron),  
1-(2-Ethoxycarbonylphenylsulfonyl)-3-(4-chlor-6-methoxypyrimidin-2-yl)harnstoff  
(Chlorimuron-ethyl),

1-(2-Methoxyphenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)harnstoff  
(Metsulfuron-methyl),  
 1-(2-Chloretoxyphenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)harnstoff  
(Triasulfuron),  
 1-(2-Methoxycarbonylphenylsulfonyl)-3-(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)harnstoff  
(Sulfumeturon-methyl),  
 1-(2-Methoxycarbonylphenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-3-  
methylharnstoff (Tribenuron-methyl),  
 1-(2-Methoxycarbonylbenzylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)harnstoff  
(Bensulfuron-methyl),  
 1-(2-Methoxycarbonylphenylsulfonyl)-3-(4,6-bis-(difluormethoxy)pyrimidin-2-yl)-  
harnstoff, (Primisulfuron-methyl),  
 3-(4-Ethyl-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2,3-dihydro-1,1-dioxo-2-methylbenzo-  
[b]thiophen-7-sulfonyl)harnstoff (EP-A 0 796 83),  
 3-(4-Ethoxy-6-ethyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2,3-dihydro-1,1-dioxo-2-methylbenzo[b]-  
thiophen-7-sulfonyl)harnstoff (EP-A 0 079 683),  
 3-(4-Methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2-methoxycarbonyl-5-jod-phenyl-  
sulfonyl)-harnstoff (WO 92/13845),  
 DPX-66037, Triflusulfuron-methyl (s. Brighton Crop Prot. Conf. - Weeds - 1995, S.  
853),  
 CGA-277476, (s. Brighton Crop Prot. Conf. - Weeds - 1995, S. 79),  
 Methyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)ureidosulfonyl]-4-methansulfon-amido-  
methyl-benzoat (WO 95/10507),  
 N,N-Dimethyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)ureidosulfonyl]-4-formylamino-  
benzamid (WO 95/01344);

B2) Thienylsulfonylharnstoffe, z.B.

1-(2-Methoxycarbonylthiophen-3-yl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-  
yl)harnstoff (Thifensulfuron-methyl);

**B3) Pyrazolylsulfonylharnstoffe, z.B.**

1-(4-Ethoxycarbonyl-1-methylpyrazol-5-yl-sulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)harnstoff (Pyrazosulfuron-methyl);

Methyl-3-chlor-5-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-ylcarbamoylsulfamoyl)-1-methyl-pyrazol-4-carboxylat (EP-A 0 282 613);

5-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl-carbamoylsulfamoyl)-1-(2-pyridyl)-pyrazol-4-carbonsäuremethylester (NC-330, s. Brighton Crop Prot. Conference 'Weeds' 1991, Vol. 1, S. 45 ff.),

DPX-A8947, Azimsulfuron, (s. Brighton Crop Prot. Conf. 'Weeds' 1995, S. 65);

**B4) Sulfondiamid-Derivate, z.B.**

3-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-(N-methyl-N-methylsulfonylaminosulfonyl)-harnstoff (Amidosulfuron) und dessen Strukturanaloge (EP-A 0 131 258 und Z. Pfl. Krankh. Pfl. Schutz, Sonderheft XII, 489-497 (1990));

**B5) Pyridylsulfonylharnstoffe, z.B.**

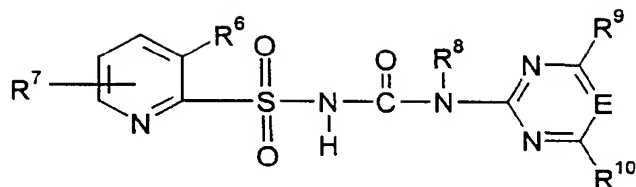
1-(3-N,N-Dimethylaminocarbonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)harnstoff (Nicosulfuron),

1-(3-Ethylsulfonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)harnstoff (Rimsulfuron),

2-[3-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)ureidosulfonyl]-6-trifluormethyl-3-pyridin-carbonsäuremethylester, Natriumsalz (DPX-KE 459, Flupyrsulfuron, s. Brighton Crop Prot. Conf. Weeds, 1995, S. 49),

Pyridylsulfonylharnstoffe, wie sie in DE-A 40 00 503 und DE-A 40 30 577 beschrieben sind, vorzugsweise solche der Formel

18



worin

E CH oder N, vorzugsweise CH,

R<sup>6</sup> Jod oder NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>,

R<sup>7</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Halogenalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkoxy-carbonyl, Mono- oder Di-((C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alkyl)-amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkylsulfinyl oder -sulfonyl, SO<sub>2</sub>-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> oder CO-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, insbesondere Wasserstoff,

R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkinyl oder zusammen -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-,

R<sup>8</sup> Wasserstoff oder CH<sub>3</sub>,

R<sup>9</sup> Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Halogenalkyl, insbesondere CF<sub>3</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Halogenalkoxy, vorzugsweise OCHF<sub>2</sub> oder OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>,

R<sup>10</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Halogenalkoxy, vorzugsweise OCHF<sub>2</sub>, oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkoxy, und

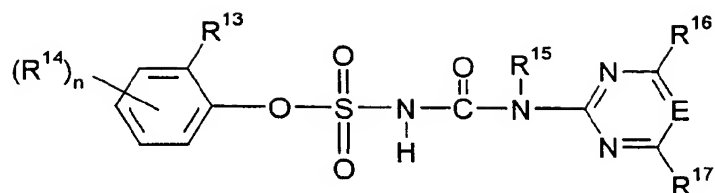
R<sup>11</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl und

R<sup>12</sup> (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl oder

R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> gemeinsam eine Kette der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SO<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>SO<sub>2</sub>- bedeuten, z.B. 3-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-(3-N-methylsulfonyl-N-methylaminopyridin-2-yl)-sulfonylharnstoff, oder deren Salze;

B6) Alkoxyphenoxy-sulfonylharnstoffe, wie sie in EP-A 0 342 569 beschrieben sind, vorzugsweise solche der Formel

19



worin

E CH oder N, vorzugsweise CH,

R<sup>13</sup> Ethoxy, Propoxy oder Isopropoxy,

R<sup>14</sup> Wasserstoff, Halogen, NO<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, CN, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Alkoxy)-carbonyl, vorzugsweise in 6-Position am Phenylring,

n 1, 2 oder 3, vorzugsweise 1,

R<sup>15</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl oder (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkenyl,

R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> unabhängig voneinander Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Halogenalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Halogenalkoxy oder (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkoxy-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alkyl,

vorzugsweise OCH<sub>3</sub> oder CH<sub>3</sub>, bedeuten, z.B. 3-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-(2-ethoxyphenoxy)-sulfonylharnstoff, oder deren Salze;

B7) Imidazolylsulfonylharnstoffe, z.B.

MON 37500, Sulfosulfuron (s. Brighton Crop Prot. Conf. 'Weeds', 1995, S: 57), und andere verwandte Sulfonylharnstoff-Derivate und Mischungen daraus;

C) Chloracetanilide, z.B.

N-Methoxymethyl-2,6-diethyl-chloracetanilid (Alachlor),

N-(3-Methoxyprop-2-yl)-2-methyl-6-ethyl-chloracetanilid (Metolachlor),

N-(3-Methyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl-methyl)-chloroessigsäure-2,6-dimethylanilid,

N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(1-pyrazolylmethyl)-chloroessigsäureamid (Metazachlor);

D) Thiocarbamate, z.B.

S-Ethyl-N,N-dipropylthiocarbamat (EPTC),

S-Ethyl-N,N-diisobutylthiocarbamat (Butylate);

## E) Cyclohexandionoxime, z.B.

3-(1-Allyloxyiminobutyl)-4-hydroxy-6,6-dimethyl-2-oxocyclohex-3-encarbon-säuremethylester, (Alloxydim),  
2-(1-Ethoxyiminobutyl)-5-(2-ethylthiopropyl)-3-hydroxy-cyclohex-2-en-1-on (Sethoxydim),  
2-(1-Ethoxyiminobutyl)-5-(2-phenylthiopropyl)-3-hydroxy-cyclohex-2-en-1-on (Cloproxydim),  
2-(1-(3-Chlorallyloxy)iminobutyl)-5-(2-ethylthiopropyl)-3-hydroxy-cyclohex-2-en-1-on,  
2-(1-(3-Chlorallyloxy)iminopropyl)-5-(2-ethylthiopropyl)-3-hydroxy-cyclohex-2-en-1-on (Clethodim),  
2-(1-Ethoxyiminobutyl)-3-hydroxy-5-(thian-3-yl)-cyclohex-2-enon (Cycloxydim),  
2-(1-Ethoxyiminopropyl)-5-(2,4,6-trimethylphenyl)-3-hydroxy-cyclohex-2-en-1-on (Tralkoxydim);

## F) Imidazolinone, z.B.

2-(4-Isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-5-methylbenzoesäure-methylester und 2-(4-Isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-4-methylbenzoesäure (Imazamethabenz),  
5-Ethyl-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-carbonsäure (Imazethapyr),  
2-(4-Isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-chinolin-3-carbonsäure (Imazaquin),  
2-(4-Isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-carbonsäure (Imazapyr),  
5-Methyl-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-carbonsäure (Imazethamethapyr);

## G) Triazolopyrimidinsulfonamid-Derivate, z.B.

N-(2,6-Difluorphenyl)-7-methyl-1,2,4-triazolo[1,5-c]pyrimidin-2-sulfonamid (Flumetsulam),

N-(2,6-Dichlor-3-methylphenyl)-5,7-dimethoxy-1,2,4-triazolo[1,5-c]pyrimidin-2-sulfonamid,

N-(2,6-Difluorphenyl)-7-fluor-5-methoxy-1,2,4-triazolo[1,5-c]pyrimidin-2-sulfonamid,

N-(2,6-Dichlor-3-methylphenyl)-7-chlor-5-methoxy-1,2,4-triazolo[1,5-c]pyrimidin-2-sulfonamid,

N-(2-Chlor-6-methoxycarbonyl)-5,7-dimethyl-1,2,4-triazolo[1,5-c]pyrimidin-2-sulfonamid (EP-A 0 343 752, US-A 4,988,812);

H) Benzoylcyclohexandione, z.B.

2-(2-Chlor-4-methylsulfonylbenzoyl)-cyclohexan-1,3-dion (SC-0051, EP-A 0 137 963), 2-(2-Nitrobenzoyl)-4,4-dimethyl-cyclohexan-1,3-dion (EP-A 0 274 634), 2-(2-Nitro-3-methylsulfonylbenzoyl)-4,4-dimethylcyclohexan-1,3-dion (WO 91/13548);

I) Pyrimidinyloxy-pyridincarbonsäure- bzw. Pyrimidinyloxybenzoesäure-Derivate, z.B.

3-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy-pyridin-2-carbonsäurebenzyl-ester (EP-A 0 249 707),

3-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy-pyridin-2-carbonsäuremethylester (EP-A 0 249 707),

2,6-Bis[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy]-benzoesäure (EP-A 0 321 846),

2,6-Bis[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy]-benzoesäure-1-(ethoxycarbonyloxyethyl)-ester (EP-A 0 472 113);

J) S-(N-Aryl-N-alkyl-carbamoylmethyl)-dithiophosphonsäureester, wie S-[N-(4-Chlorphenyl)-N-isopropyl-carbamoylmethyl]-O,O-dimethyl-dithiophosphat (Anilophos).

Die Herbizide der Gruppen A bis J sind beispielsweise aus den oben jeweils genannten Schriften und aus "The Pesticide Manual", The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 10th Edition, 1994, "Agricultural

Chemicals Book II - Herbicides -", by W.T. Thompson, Thompson Publications, Fresno CA, USA 1990 und "Farm Chemicals Handbook '90", Meister Publishing Company, Willoughby OH, USA, 1990, bekannt.

Das Gewichtsverhältnis Safener zu Pestizid kann innerhalb weiter Grenzen variiert werden und liegt vorzugsweise im Bereich von 1:10 bis 10:1, insbesondere 1:10 bis 5:1. Das optimale Gewichtsverhältnis Safener zu Pestizid hängt sowohl von den eingesetzten Wirkstoffen Safener und Pestizid als auch von der Art der zu schützenden Nutzpflanzen ab. Die erforderliche Aufwandmenge an Safener kann je nach verwendetem Pestizid und Art der zu schützenden Nutzpflanze innerhalb weiter Grenzen variiert werden und liegt in der Regel im Bereich von 0,001 bis 5 kg, vorzugsweise 0,005 bis 0,5 kg Safener je Hektar. Die für eine erfolgreiche Behandlung notwendigen Mengen und Gewichtsverhältnisse können durch einfache Vorversuche ermittelt werden.

In der Regel können die erfindungsgemäßen Mittel zum Schutz verschiedener Nutzpflanzenkulturen wie Baumwolle, Getreide, Mais, Raps, Reis und Sojabohne eingesetzt werden. Bevorzugte Nutzpflanzenkulturen sind Getreide und Mais.

Ein besonderer Vorteil der erfindungsgemäßen Safener der Formel I ist bei deren Kombination mit Herbiziden aus der Gruppe der Sulfonylharnstoffe und/oder Imidazolinone sowie mit Herbiziden vom Typ der Phenoxyphenoxy- und Heteroaryloxyphenoxy-alkancarbonsäure-Derivate festzustellen. Zahlreiche Herbizide dieser Strukturklassen verursachen nämlich speziell in Getreidekulturen, Mais sowie Reis beträchtliche Schäden an den Nutzpflanzen und können bisher in diesen Kulturen nicht immer eingesetzt werden. Durch die Kombination mit den erfindungsgemäßen Safenern sind auch bei diesen Herbiziden in Getreide, Mais oder Reis hervorragende Selektivitäten zu erreichen.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel I und deren Kombinationen mit einem oder mehreren der genannten Pestizide können in Abhängigkeit von den



vorgegebenen chemisch-physikalischen und biologischen Parametern auf verschiedene Arten formuliert werden. Als Formulierungsarten sind beispielsweise geeignet:

- Emulgierbare Konzentrate, die durch Auflösen der Wirkstoffe in einem organischen Lösungsmittel, z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höher siedenden Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt werden. Geeignete Emulgatoren sind beispielsweise alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze, Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykoether, Fettalkoholpolyglykoether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester und Polyoxyethylensorbitanfettsäureester
- Stäubemittel, die durch Vermahlen der Wirkstoffe mit fein-verteilten festen anorganischen oder organischen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, Diatomeenerde oder Mehlen erhalten werden
- Auf Wasser oder Öl basierende Suspensionskonzentrate, die beispielsweise durch Naßvermahlung mittels Perlmühlen hergestellt werden können
- Wasserlösliche Pulver
- Wasserlösliche Konzentrate
- Granulate, wie wasserlösliche Granulate, wasserdispergierbare Granulate sowie Granulate für die Streu- und Bodenapplikation
- Spritzpulver, die neben Wirkstoff noch Verdünnungs- oder Inertstoffe und Tenside enthalten
- Kapselsuspensionen und Mikro kapseln
- Ultra-Low-Volume-Formulierungen.

Die oben genannten Formulierungsarten sind dem Fachmann bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed., G. Goodwin Ltd., London. 1979; W. van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y. 1973; Winnaker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C.

Hauser Verlag München, 4. Auflage 1986; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, N.Y. 1973, Seiten 8-57.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; H. von Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Auflage 1986.

Außer den vorstehend genannten Formulierungshilfsmitteln können die nutzpflanzenschützenden Mittel gegebenenfalls übliche Haft-, Netz-, Dispergier-, Penetrations-, Emulgier-, Konservierungs-, Frostschutz-, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer sowie den pH-Wert oder die Viskosität beeinflussende Mittel enthalten.

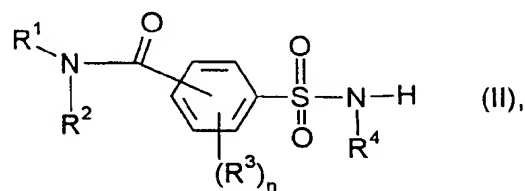
Je nach Art der Formulierung enthalten die nutzpflanzenschützenden Mittel in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,2 bis 95 Gew.-%, eines oder mehrerer Safener der allgemeinen Formel I oder eine Kombination von Safener und Pestizid. Weiterhin enthalten sie 1 bis 99,9, insbesondere 4 bis 99,5 Gew.-%, eines oder mehrerer fester oder flüssiger Zusatzstoffe und 0 bis 25, insbesondere 0,1 bis 25 Gew.-% eines Tensids. In emulgierbaren Konzentraten beträgt die Wirkstoffkonzentration, d.h. die Konzentration von Safener und/oder Pestizid, in der Regel 1 bis 90, insbesondere 5 bis 80 Gew.-%. Stäubemittel enthalten üblicherweise 1 bis 30, vorzugsweise 5 bis 20 Gew.-% Wirkstoff. In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration in der Regel 10 bis 90 Gew.-%. Bei den in

Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

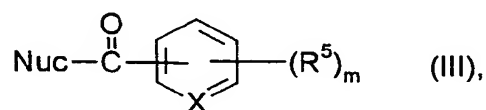
Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Granulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt. Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids u. a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Safener.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel I können hergestellt werden, indem man beispielsweise

a) eine Verbindung der allgemeinen Formel II

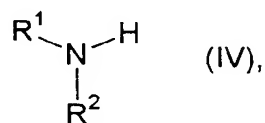


worin  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^4$  und  $n$  wie oben definiert sind, mit einem Acylierungsmittel, z.B. einem Carbonsäurehalogenid, Carbonsäureanhydrid oder Carbonsäure-imidazolid, der Formel III

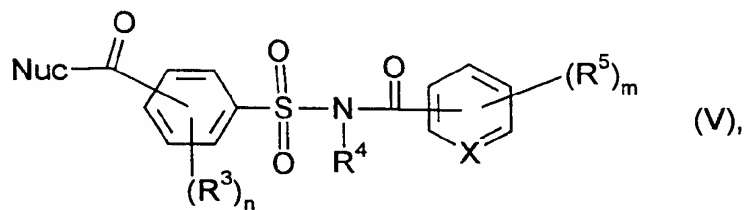


worin Nuc eine Abgangsgruppe und X, R<sup>5</sup> und m wie oben definiert sind, umgesetzt, oder eine Verbindung der allgemeinen Formel III, in der Nuc für Hydroxy steht, unter Verwendung von Kupplungsreagenzien wie Dicyclohexylcarbodiimid mit dem Sulfonamid der Formel II umgesetzt, oder

b) eine Verbindung der allgemeinen Formel IV



worin R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> wie oben definiert sind, mit geeigneten aktivierten Carbonsäure-Derivaten der allgemeinen Formel V



worin X, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, n und m wie oben definiert sind und Nuc eine Abgangsgruppe bedeutet, umgesetzt.

Die Umsetzungen nach Varianten a) und b) erfolgen vorzugsweise in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart eines säurebindenden Mittels. Als

Lösungsmittel eignen sich beispielsweise aprotische polare Lösungsmittel, z.B. Ether, wie THF (Tetrahydrofuran), Dioxan, Acetonitril und Dimethylformamid. Als säurebindende Mittel werden Basen, vorzugsweise organische Basen, wie Triethylamin, Pyridin, Dimethylaminopyridin, DBU (1,8-Diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-en), DBN (1,5-Diazabicyclo[4.3.0]non-5-en) und 1,4-Diaza-bicyclo[2.2.2]octan verwendet. Die Reaktionstemperaturen liegen vorzugsweise im Bereich zwischen -20° C und 120° C. Die Verbindungen der allgemeinen Formeln II, III, IV und V sind entweder käuflich oder können nach dem Fachmann bekannten Methoden hergestellt werden.

**BEISPIELE****1 FORMULIERUNGSBEISPIELE****1.1 STÄUBEMITTEL**

Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel I oder eines Wirkstoffgemischs aus einem Herbizid und einem Safener der Formel I und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

**1.2 WASSERDISPERGIERBARES PULVER**

Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel I oder eines Wirkstoffgemischs aus einem Herbizid und einem Safener der Formel I, 64 Gewichtsteile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoymethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

**1.3 WASSERDISPERGIERBARES KONZENTRAT**

Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel I oder eines Wirkstoffgemischs aus einem Herbizid und einem Safener der Formel I mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether (<sup>®</sup>Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykolether und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

**1.4 EMULGIERBARES KONZENTRAT**

Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel I oder eines Wirkstoffgemischs aus einem Herbizid und einem Safener

der Formel I, 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.

### 1.5 WASSERDISPERGIERBARES GRANULAT

Ein in Wasserdispergierbares Granulat wird erhalten, indem man

75		Gewichtsteile eines Safeners der Formel I oder eines Gemischs
		eines Pestizids und eines Safeners der Formel I,
10	"	ligninsulfonsaures Calcium,
5	"	Natriumlaurylsulfat,
3	"	Polyvinylalkohol und
7	"	Kaolin

mischt, in einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.

Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man

25		Gewichtsteile eines Safeners der Formel I oder eines Gemischs
		eines Pestizids und eines Safeners der Formel I,
5	"	2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium,
2	"	oleoymethyltaurinsaures Natrium,
17	"	Calciumcarbonat,
50	"	Wasser und
1		Gewichtsteil Polyvinylalkohol

auf einer Kolloidmühle homogenisiert, zerkleinert, dann in einer Perlmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

## 2 HERSTELLUNGSBEISPIELE

### 2.1 4-(2-CHLORBENZOYLSULFAMOYL)-N-PROPYLBENZAMID

(Beispiel 1-19 aus Tabelle 1)

#### 2.1.1 N-PROPYL-4-SULFAMOYLBENZAMID

10 g (0.05 mol) 4-Sulfamoylbenzoesäure werden in 100 ml Tetrahydrofuran bei Raumtemperatur gelöst und mit 8.1 g (0.05 mol) N,N'-Carbonyldiimidazol versetzt. Nach 30 Minuten bei Raumtemperatur und weiteren 30 Minuten bei Rückflußtemperatur werden 2.9 g (0.05 mol) Propylamin bei Raumtemperatur zugegeben. Nach 2 Stunden wird die Reaktionsmischung eingeeengt, mit Wasser verrührt, der Niederschlag abgesaugt und getrocknet. Ausbeute: 8.8 g (70 %); Schmp.: 203° C.

#### 2.1.2 4-(2-CHLORBENZOYLSULFAMOYL)-N-PROPYLBENZAMID

1.3 g (8.3 mmol) 2-Chlorbenzoesäure werden in 100 ml Tetrahydrofuran bei Raumtemperatur gelöst und mit 1.3 g (8.3 mmol) N,N'-Carbonyldiimidazol versetzt. Nach 30 Minuten bei Raumtemperatur und weiteren 30 Minuten bei Rückflußtemperatur werden 2.0 g (8.3 mmol) N-Propyl-4-sulfamoylbenzamid bei Rückflußtemperatur zugegeben. Nach 10 Minuten werden 1.2 g (8.3 mmol) 1,5-Diazabicyclo(5.4.0)-5-undecen zugefügt und die Mischung weitere 3 Stunden lang auf Rückflußtemperatur gehalten. Anschließend engt man bis zur Trockne ein, nimmt den Rückstand in 60 ml Acetonitril auf und gibt die Lösung in 60 ml Wasser. Nach Ansäuern der Lösung mit 2N HCl auf einen pH-Wert von 1 wird der Niederschlag abgetrennt, mit Wasser gewaschen und getrocknet. Ausbeute: 1.8 g (54 %); Schmp.: 210° C.



**2.2 2,4-DICHLOR-5-(2-CHLORBENZOYLSULFAMOYL)-N-(2-METHOXYETHYL)-BENZAMID**  
(Beispiel 2-39 aus Tabelle 2)

**2.2.1. 2,4-DICHLOR-N-(2-METHOXYETHYL)-5-SULFAMOYLBENZAMID**

15 g (56 mmol) 2,4-Dichlor-5-sulfamoylbenzoesäure werden in 350 ml Tetrahydrofuran gelöst und bei Raumtemperatur mit 9 g (56 mmol) N,N'-Carbonyldiimidazol versetzt. Nach 30 Minuten bei Raumtemperatur und weiteren 30 Minuten bei Rückflußtemperatur werden 4.2 g (56 mmol) 2-Methoxyethylamin bei Raumtemperatur zugegeben. Nach 4 Stunden wird die Reaktionsmischung eingeeengt, mit Wasser verrührt, der Niederschlag abgesaugt und getrocknet. Ausbeute: 11.7 g (61 %); Schmp.: 158° C.

**2.2.2. 2,4-DICHLOR-5-(2-CHLORBENZOYLSULFAMOYL)-N-(2-METHOXYETHYL)-BENZAMID**

1.0 g (6.1 mmol) 2-Chlorbenzoesäure werden in 120 ml Tetrahydrofuran bei Raumtemperatur gelöst und mit 1.0 g (6.1 mmol) N,N'-Carbonyldiimidazol versetzt. Nach 30 Minuten bei Raumtemperatur und weiteren 30 Minuten bei Rückflußtemperatur werden 2.0 g (6.1 mmol) 2,4-Dichlor-N-(2-methoxyethyl)-5-sulfamoylbenzamid bei Rückflußtemperatur zugegeben. Nach 10 Minuten werden 0.9 g (6.1 mmol) 1,5-Diazabicyclo(5.4.0)-5-undecen zugefügt und die Mischung weitere 3 Stunden lang auf Rückflußtemperatur gehalten. Anschließend engt man bis zur Trockne ein, nimmt den Rückstand in 60 ml Acetonitril auf und gibt die Lösung in 60 ml Wasser. Nach Ansäuern der Lösung mit 2N HCl auf einen pH-Wert von 1 wird der Niederschlag abgetrennt, mit Wasser gewaschen und getrocknet. Ausbeute: 1.8 g (61%); Schmp.: 181° C.

### **3 BIOLOGISCHE BEISPIELE**

#### **3.1 BONITIERUNG DER SCHADWIRKUNG**

Die Schadwirkung an den Pflanzen wird nach einer Skala von 0-100 % optisch im Vergleich zu Kontrollpflanzen bewertet:

- 0% = keine erkennbare Wirkung im Vergleich zur unbehandelten Pflanze  
100% = behandelte Pflanze stirbt ab.

#### **3.2 HERBIZIDWIRKUNG UND SAFENERWIRKUNG IM VORAUFLAUF**

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Schadpflanzen sowie von Kulturpflanzen werden in Plastiktöpfen von 9 cm Durchmesser in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Alternativ hierzu werden im Paddy-Reisanbau vorkommende Schadpflanzen in einem mit Wasser gesättigten Boden kultiviert, wobei so viel Wasser in die Töpfe gefüllt wird, daß das Wasser bis zur Bodenoberfläche oder einige Millimeter darüber steht. Die in Form von Emulsionskonzentraten formulierten erfindungsgemäßen Herbizid-Safener-Wirkstoffkombinationen sowie in parallelen Versuchen die entsprechend formulierten Einzelwirkstoffe werden dann als Emulsionen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 300 l/ha, in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert oder beim Reis ins Bewässerungswasser gegossen. Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. der Auflaufschäden erfolgt nach dem Auflaufen der Versuchspflanzen nach einer Versuchszeit von 2-3 Wochen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen. Wie die Versuche zeigen, weisen die erfindungsgemäßen herbiziden Mittel, welche z.B. einen Safener der Beispiele 1-17, 1-20, 1-33, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-75, 1-76, 1-84, 1-85, 1-86, 1-117, 1-118, 1-133, 1-150, 1-151, 1-153, 1-162, 1-163, 1-195, 1-197 in Kombination mit dem Sulfonylharnstoffherbizid 3-(4,6-Dimethoxypyrimid-2-yl)-1-[3-(N-methylsulfonyl-N-methylamino)-pyridyl-2-yl-sulfonyl]-harnstoff oder 3-(4-Methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2-methoxycarbonyl-5-jod-phenyl-sulfonyl)-harnstoff (Natriumsalz)

oder 1-(2-Methoxycarbonylthiophen-3-yl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)harnstoff (Thifensulfuron-methyl) oder 1-(3-N,N-Dimethyl-aminocarbonyl-pyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)harnstoff (Nicosulfuron) oder 1-(3-Ethylsulfonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-harnstoff (Rimsulfuron) oder N,N-Dimethyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-ureidosulfonyl]-4-formylaminobenzamid oder Methyl-2-[3-(4,6-dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-ureidosulfonyl]-4-methansulfonamido-methyl-benzoat oder mit dem Imidazolinonherbizid 5-Ethyl-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-carbonsäure (Imazethapyr) oder mit dem Aryloxyphenoxyherbizid 2-(4-(6-Chlorbenzoxazol-2-yl-oxy)-phenoxy)-propionsäureethyl-ester Fenoxaprop-ethyl) oder mit 2,6-Bis[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy]-benzoesäure Natriumsalz im Verhältnis von Herbizid:Safener von 2:1 bis 1:20 enthalten, eine gute herbizide Voraufwirkung gegen ein breites Spektrum von Unkräutern und Ungräsern auf, wobei Schäden an Kulturpflanzen wie Mais, Reis, Weizen oder Gerste oder anderem Getreide im Vergleich zur Anwendung der einzelnen Herbizide ohne Safener wesentlich reduziert sind, d.h. um 30% bis zu 100% weniger Herbizidschäden aufweisen.

### 3.3 HERBIZIDWIRKUNG UND SAFENERWIRKUNG IM NACHAUFLAUF

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Schadpflanzen und von Kulturpflanzen werden in Plastiktöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Alternativ hierzu werden im Paddy-Reisanbau vorkommende Schadpflanzen in Töpfen kultiviert, in denen Wasser bis zu 2 cm über der Bodenoberfläche steht. Drei Wochen nach der Aussaat werden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt. Die als Emulsionskonzentrate formulierten erfindungsgemäßen Herbizid-Safener-Wirkstoffkombinationen sowie in parallelen Versuchen die entsprechend formulierten Einzelwirkstoffe werden in verschiedenen Dosierungen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 300 l/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht und nach 2-3 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen die Wirkung der Präparate optisch im

Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert. Bei Reis oder bei Schadpflanzen, die im Reisanbau vorkommen, werden die Wirkstoffe auch direkt ins Bewässerungswasser gegeben (Applikation in Analogie zur sogenannten Granulatanwendung) oder auf Pflanzen und ins Bewässerungswasser gesprüht. Wie die Versuche zeigen, weisen die erfindungsgemäßen herbiziden Mittel, welche z.B. einen Safener der Beispiele 1-17, 1-20, 1-33, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-75, 1-76, 1-84, 1-85, 1-86, 1-117, 1-118, 1-133, 1-150, 1-151, 1-153, 1-162, 1-163, 1-195, 1-197 in Kombination mit dem Sulfonylharnstoffherbizid 3-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-[3-(N-methylsulfonyl-N-methylamino)-pyridyl-2-yl-sulfonyl]-harnstoff oder 3-(4-Methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2-methoxycarbonyl-5-jod-phenylsulfonyl)-harnstoff (Natriumsalz) oder 1-(2-Methoxycarbonylthiophen-3-yl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)harnstoff (Thifensulfuron-methyl) oder 1-(3-N,N-Dimethylaminocarbonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-harnstoff (Nicosulfuron) oder 1-(3-Ethylsulfonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)harnstoff (Rimsulfuron) oder N,N-Dimethyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)ureidosulfonyl]-4-formylaminobenzamid oder Methyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)ureido-sulfonyl]-4-methansulfonamido-methyl-benzoat oder mit dem Imidazolinonherbizid 5-Ethyl-2-(4-isopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-carbonsäure (Imazethapyr) oder mit dem Aryloxyphenoxyherbizid 2-(4-(6-Chlorbenzoxazol-2-yl-oxy)-phenoxy)-propionsäureethylester (Fenoxaprop-ethyl) oder mit 2,6-Bis[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy]-benzoesäure Natriumsalz im Verhältnis von Herbizid:Safener von 2:1 bis 1:20 enthalten, eine gute herbizide Nachaufwirkung gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf, wobei Schäden an Kulturpflanzen wie Mais, Reis, Weizen oder Gerste oder anderem Getreide im Vergleich zur Anwendung der einzelnen Herbizide ohne Safener wesentlich reduziert sind, d.h. um 30% bis zu 100% weniger Herbizidschäden aufweisen.

In den nachfolgenden Tabellen sind beispielhaft eine Reihe von Verbindungen der allgemeinen Formel I aufgeführt, die in analoger Weise zu den obigen Beispielen und den weiter oben erwähnten Methoden erhalten werden können.

In den Tabellen bedeuten:

Bu = Butyl

Et = Ethyl

Me = Methyl

Nap = Naphthoyl

Pr = Propyl

c = cyclo

i = iso

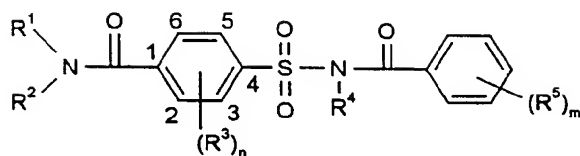
s = sekundär

t = tertiär

F.P. = Festpunkt

Ist den Tabellen ein Alkylrest ohne weitere Kennzeichnung aufgeführt, so handelt es sich um den geradkettigen.

Tabelle 1:



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	F.P. [°C]
1-1	Bu	H	-	H	2-OMe	178
1-2	Bu	H	-	H	2-OMe, 5-Me	196
1-3	Bu	H	-	H	2-Cl	131
1-4	Bu	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	209
1-5	Bu	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-6	Bu	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-7	Bu	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
1-8	Bu	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-9	Bu	H	-	Me	2-OMe	
1-10	Bu	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-11	Bu	H	-	Me	2-Cl	
1-12	Bu	H	-	Me	2-OMe, 5-Cl	
1-13	Bu	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe	
1-14	Bu	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-15	Bu	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-Cl	
1-16	Bu	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
1-17	Pr	H	-	H	2-OMe	170
1-18	Pr	H	-	H	2-Me	120
1-19	Pr	H	-	H	2-Cl	210
1-20	Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Me	170

1-21	Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	180
1-22	Pr	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	200
1-23	Pr	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-24	Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
1-25	Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
1-26	Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-27	Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe	197
1-28	Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Cl	
1-29	Pr	H	-	Me	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
1-30	Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-31	Pr	H	-	Me	2-OMe	
1-32	Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	Me	2-OMe, 5-Me	
1-33	Allyl	H	-	H	2-OMe, 5-Me	161
1-34	Allyl	H	-	H	2-Me	195
1-35	Allyl	H	-	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	178
1-36	Allyl	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	185
1-37	Allyl	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	181
1-38	Allyl	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	174
1-39	Allyl	H	-	H	2-Cl	201
1-40	Allyl	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
1-41	Allyl	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe	
1-42	Allyl	H	-	Me	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-43	Allyl	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-44	Allyl	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-45	Allyl	Allyl	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	125
1-46	Allyl	Allyl	-	H	2-Me	120
1-47	Allyl	Allyl	-	H	2-OMe, 5-Me	120
1-48	Allyl	Allyl	-	H	2-OMe, 5-Cl	105
1-49	Allyl	Allyl	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	158
1-50	Allyl	Allyl	-	H	2-Cl	96
1-51	Allyl	Allyl	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	144
1-52	Allyl	H	-	H	1-MeO-2-Nap	180

1-53	Allyl	Me	-	H	2-Me	171
1-54	Allyl	Me	-	H	2-OMe	
1-55	Allyl	Me	-	H	2-OMe, 5-Me	
1-56	Allyl	Me	-	H	2-Ome; 5-Cl	214
1-57	Allyl	Me	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
1-58	c-Hexyl	H	-	H	2-Cl	
1-59	c-Hexyl	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-60	c-Hexyl	H	-	Me	2-OMe, 5-Cl	
1-61	c-Pentyl	H	-	H	2-OMe	206
1-62	c-Pentyl	H	-	H	2-Me	188
1-63	c-Pentyl	H	-	H	2-Cl	220
1-64	c-Pentyl	H	-	H	2-OMe, 5-Me	
1-65	c-Pentyl	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-66	c-Pentyl	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-67	c-Pr	H	-	H	2-OMe	218
1-68	c-Pr	H	-	H	2-Cl	207
1-69	c-Pr	H	-	H	2-Me	226
1-70	c-Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Me	211
1-71	c-Pr	H	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	229
1-72	c-Pr	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	205
1-73	c-Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	208
1-74	c-Pr	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	233
1-75	c-Pr	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	225
1-76	c-Pr	H	-	Me	2-OMe	70
1-77	c-Pr	H	-	Me	2-Me	122
1-78	c-Pr	H	-	Me	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-79	c-Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-80	c-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-81	c-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-82	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-Cl	138
1-83	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-OMe	161
1-84	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-Me	162



1-85	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-OMe	187
1-86	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-Cl	163
1-87	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	179
1-88	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	185
1-89	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	195
1-90	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-Me	159
1-91	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-OMe, 5-Me	186
1-92	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-93	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	193
1-94	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	Me	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
1-95	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	Me	2-Me	
1-96	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-97	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OEt	H	-	Me	2-OMe, 5-Cl	
1-98	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> -OMe	H	-	H	2-OMe	142
1-99	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> -OMe	H	-	H	2-Me	93
1-100	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> -OMe	H	-	H	2-Cl	147
1-101	CH <sub>2</sub> -2-Furanyl	H	-	H	2-Me	205
1-102	CH <sub>2</sub> -2-Furanyl	H	-	H	2-OMe	190
1-103	CH <sub>2</sub> -2-Furanyl	H	-	H	2-Cl	207
1-104	CH <sub>2</sub> -2-Furanyl	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	170
1-105	CH <sub>2</sub> -2-Furanyl	H	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	200
1-106	CH <sub>2</sub> -2-Furanyl	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	163
1-107	CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	209
1-108	CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	145
1-109	CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	-	H	2-Me	115
1-110	CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Me	182
1-111	CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	192
1-112	CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	-	H	2-Cl	141
1-113	CH <sub>2</sub> -c-Pr	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	153
1-114	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	175
1-115	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	192
1-116	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2-Me	215

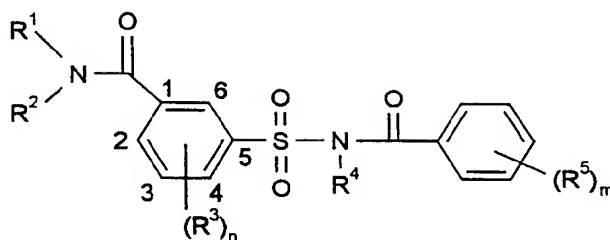
1-117	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2-OMe, 5-Me	166
1-118	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	185
1-119	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	182
1-120	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-121	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	H	2-Cl	220
1-122	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-123	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	-	Me	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-124	CH <sub>2</sub> C≡CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-125	CH <sub>2</sub> C≡CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	-	H	2-OMe, 5-Me	
1-126	CH <sub>2</sub> C≡CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	-	Me	2,5- (Me) <sub>2</sub>	
1-127	CH <sub>2</sub> C≡CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-128	CH <sub>2</sub> -t-Bu	H	-	H	2-Cl	213
1-129	CH <sub>2</sub> -t-Bu	H	-	H	2-OMe	170
1-130	CH <sub>2</sub> -t-Bu	H	-	H	2-Me	176
1-131	CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	H	-	H	2-OMe	130
1-132	CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	H	-	H	2-Me	140
1-133	Et	Et	-	H	2-OMe	136
1-134	Et	Et	-	H	2-Cl	180
1-135	Et	Et	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	155
1-136	Et	Et	-	H	2-OMe	
1-137	Et	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-138	Et	H	-	H	2-OMe, 5-Me	
1-139	Et	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-140	Et	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
1-141	Et	H	-	Me	2-OMe	
1-142	Et	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-143	Et	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-144	i-Bu	H	-	H	2-OMe	160
1-145	i-Bu	H	-	H	2-Me	150
1-146	i-Bu	H	-	H	2-Cl	169
1-147	i-Bu	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	

1-148	i-Bu	H	-	H	2-OMe, 5-Me	
1-149	i-Bu	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-150	i-Pr	H	-	H	2-Me	200
1-151	i-Pr	H	-	H	2-OMe	224
1-152	i-Pr	H	-	H	2-Cl	228
1-153	i-Pr	H	-	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	258
1-154	i-Pr	H	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	243
1-155	i-Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-156	i-Pr	H	-	Me	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-157	i-Pr	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-158	i-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-Me	
1-159	i-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-160	i-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-161	Me	H	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	227
1-162	Me	H	-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	278
1-163	Me	H	-	H	2-Me	205
1-164	Me	H	-	H	2-OMe, 5-Me	201
1-165	Me	H	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	231
1-166	Me	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-167	Me	H	-	H	2-Cl	238
1-168	Me	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-169	Me	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-170	Me	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	
1-171	Me	H	-	Me	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-172	Me	Et	-	H	2-Cl	188
1-173	Me	Et	-	H	2-OMe	155
1-174	Me	Et	-	H	2-Me	203
1-175	Me	Et	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-176	Me	Et	-	H	2-OMe, 5-Me	
1-177	Me	Et	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
1-178	Me	Et	-	Me	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-179	Me	Me	-	H	2-OMe	136

1-180	Me	Me	-	H	2-Me	246
1-181	Me	Me	-	H	2-Cl	231
1-182	Me	Me	-	H	2-OMe, 5-Me	150
1-183	Me	Me	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	167
1-184	Me	Me	-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	205
1-185	Me	Allyl	-	H	2-Cl	177
1-186	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		-	H	2-OMe	212
1-187	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		-	H	2-Me	231
1-188	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-189	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
1-190	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		-	H	2-OMe, 5-Me	230
1-191	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		-	H	2-Cl	
1-192	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	212
1-193	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	201
1-194	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	202
1-195	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2-Me	206
1-196	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2-Cl	225
1-197	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2-OMe, 5-Me	
1-198	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2-OMe, 5-Cl	73
1-199	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	1-MeO-2-Nap	158
1-200	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-201	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	157
1-202	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2,5- Cl <sub>2</sub>	
1-203	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
1-204	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2-Me	195
1-205	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2-Cl	
1-206	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2-OMe, 5-Me	
1-207	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2-OMe, 5-Cl	169
1-208	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
1-209	-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-	H	2-OMe, 5-Me	158
1-210	-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	172
1-211	-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	

1-212	-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-	H	2-OMe	201
1-213	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		-	Me	2-OMe, 5-Cl	Harz
1-214	Me	Et	-	Me	2-OMe	111
1-215	Pr	Pr	-	H	2-OMe, 5-Cl	143
1-216	Pr	Pr	-	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	134
1-217	Et	H	-	H	2-OMe	285
1-218	Et	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	271
1-219	CH <sub>2</sub> C≡CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	-	H	2-OMe, 5-Cl	183
1-220	CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	177
1-221	CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	-	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	206
1-222	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-	H	2-OMe	222
1-223	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	235
1-224	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	264
1-225	c-Pr	H	-	H	2-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -3	264
1-226	s-Bu	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	192
1-227	s-Bu	H	-	H	2-OMe	183
1-228	2-Heptyl	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	110
1-229	2-Heptyl	H	-	H	2-OMe	143
1-230	Me	Me	-	H	2-OMe, 5-Cl	154
1-231	Me	Et	-	Me	2-Me	Harz
1-232	c-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe	234
1-233	Pr	H	2-Cl	H	2-Me	76
1-234	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe	244
1-235	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe-5-Cl	199

Tabelle 2:



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	F.P [°C]
2-1	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	159
2-2	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe	141
2-3	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-Cl	127
2-4	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-Me	
2-5	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
2-6	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
2-7	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
2-8	Pr	H	2,4 Cl <sub>2</sub>	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-9	Pr	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	Me	2-OMe, 5-Me	
2-10	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Me	
2-11	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Cl	
2-12	Pr	H	H	H	2-OMe	
2-13	Pr	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-14	Bu	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-15	Bu	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
2-16	Bu	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
2-17	Bu	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-18	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Me	
2-19	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Cl	

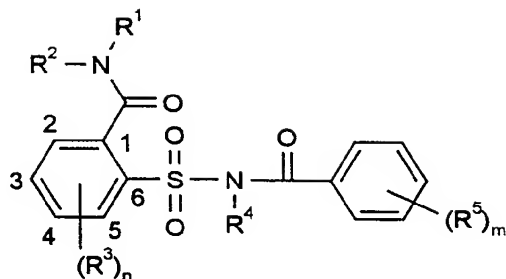
2-20	Bu	H	H	H	2-OMe	202
2-21	Bu	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-22	Me	H	4-Cl	H	2-Cl	
2-23	Me	H	4-Cl	H	2-Me	204
2-24	Me	H	4-Cl	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	215
2-25	Me	Me	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
2-26	Me	Me	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
2-27	Me	Me	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-28	Me	Me	4-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
2-29	Me	Me	4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
2-30	Me	Me	4-Cl	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-31	Me	Me	4-Cl	Me	2-OMe, 5-Me	
2-32	Me	Me	H	H	2-OMe, 5-Me	
2-33	Me	Me	H	H	2-OMe, 5-Cl	Harz
2-34	Me	Me	H	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-35	Me	Me	H	H	2-OMe	202
2-36	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe	177
2-37	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	2,4- Cl <sub>2</sub>	H	2-Me	180
2-38	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-39	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-Cl	181
2-40	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	203
2-41	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	264
2-42	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe	174
2-43	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-Cl	214
2-44	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-Me	
2-45	c-Pr	H	4-Cl	H	2-OMe	180
2-46	c-Pr	H	4-Cl	H	2-Me	250
2-47	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	233
2-48	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
2-49	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
2-50	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
2-51	c-Pr	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	

2-52	c-Pr	H	4-Cl	H	2-Cl	222
2-53	c-Pr	H	4-Cl	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-54	c-Pr	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
2-55	c-Pr	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
2-56	c-Pr	H	4-Cl	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-57	c-Pr	H	4-Cl	Me	2-OMe, 5-Me	
2-58	c-Pr	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-59	c-Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Me	
2-60	c-Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Cl	
2-61	c-Pr	H	H	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-62	Allyl	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe	188
2-63	Allyl	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-Cl	147
2-64	Allyl	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-Me	
2-65	Allyl	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-66	Allyl	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	90
2-67	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-68	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
2-69	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
2-70	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-71	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	Me	2-OMe, 5-Me	
2-72	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	4-Cl	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-73	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
2-74	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
2-75	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	4-Cl	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-76	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-77	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
2-78	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
2-79	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		2,4-Cl <sub>2</sub>	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-80	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		2,4-Cl <sub>2</sub>	Me	2-OMe, 5-Me	
2-81	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		4-Cl	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
2-82	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		4-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
2-83	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	



2-84	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		4-Cl	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
2-85	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		4-Cl	H	2-OMe	
2-86	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		4-Cl	H	2-Cl	
2-87	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		4-Cl	H	2-Me	
2-88	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		H	H	2-OMe, 5-Cl	178
2-89	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		H	H	2-OMe	154
2-90	Me	Et	H	H	2-OMe, 5-Cl	82
2-91	Me	Et	H	H	2-OMe	71
2-92	c-Pr	H	H	H	2-OMe	185
2-93	c-Pr	H	H	H	2-OMe	183
2-94	c-Pr	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	216
2-95	i-Pr	H	H	H	2-OMe	179
2-96	i-Pr	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	178
2-97	Me	H	H	H	2-OMe	117
2-98	Me	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	156

Tabelle 3:

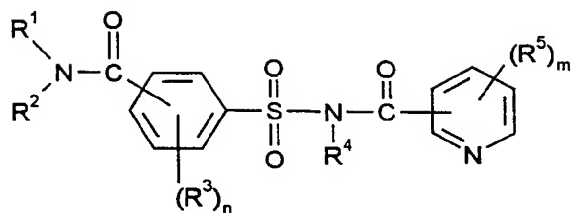


Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	F.P. [°C]
3-1	Pr	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-2	Pr	H	H	H	2-OMe	
3-3	Pr	H	H	H	2-Cl	
3-4	Pr	H	H	H	2-Me	
3-5	Pr	H	H	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
3-6	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Me	
3-7	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Cl	
3-8	Pr	H	H	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
3-9	Pr	H	H	Me	2-OMe, 5-Me	
3-10	Pr	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
3-11	Pr	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
3-12	Pr	H	2-Cl	H	2-OMe	
3-13	Pr	H	2-Cl	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-14	Bu	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-15	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Me	
3-16	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Cl	
3-17	Bu	H	H	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
3-18	Bu	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
3-19	Bu	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
3-20	Bu	H	2-Cl	H	2-OMe	

3-21	Bu	H	2-Cl	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-22	Me	H	2-Cl	H	2-Cl	
3-23	Me	H	2-Cl	H	2-Me	
3-24	Me	H	2-Cl	H	2,3-(Me) <sub>2</sub>	
3-25	Me	Me	H	H	2-OMe, 5-Me	
3-26	Me	Me	H	H	2-OMe, 5-Cl	
3-27	Me	Me	H	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
3-28	Me	Me	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
3-29	Me	Me	2-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
3-30	Me	Me	2-Cl	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
3-31	Me	Me	2-Cl	Me	2-OMe, 5-Me	
3-32	Me	Me	4-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Me	
3-33	Me	Me	4-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe, 5-Cl	
3-34	Me	Me	4-NO <sub>2</sub>	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
3-35	Me	Me	4-NO <sub>2</sub>	H	2-OMe	
3-36	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	H	H	2-OMe	
3-37	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	H	H	2-Me	
3-38	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-39	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	H	H	2-Cl	
3-40	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	
3-41	c-Pr	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-42	c-Pr	H	H	H	2-OMe	
3-43	c-Pr	H	H	H	2-Cl	
3-44	c-Pr	H	H	H	2-Me	
3-45	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe	
3-46	c-Pr	H	2-Cl	H	2-Me	
3-47	c-Pr	H	2-Cl	H	2-Cl	
3-48	c-Pr	H	2-Cl	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-49	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me	
3-50	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
3-51	c-Pr	H	2-Cl	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
3-52	c-Pr	H	2-Cl	Me	2-OMe, 5-Me	
3-53	Allyl	H	H	H	2-OMe	

	Allyl	H	H	H	2-Cl	
3-55	Allyl	H	H	H	2-Me	
3-56	Allyl	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-57	Allyl	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	
3-58	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	H	H	2,5-(Me) <sub>2</sub>	
3-59	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	H	H	2-OMe, 5-Me	
3-60	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	H	H	2-OMe, 5-Cl	
3-61	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	H	H	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl	
3-62	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	H	Me	2-OMe, 5-Me	

Tabelle 4:



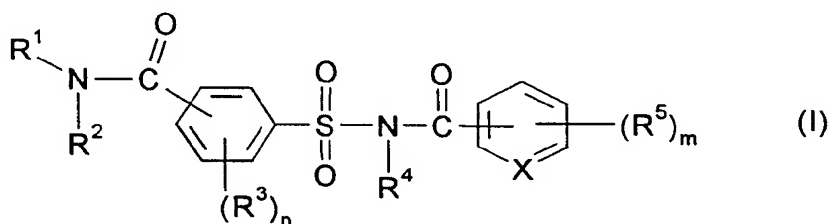
Nr.	Verbindung	F.P. [°C]
4-1	4-(2-Methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-propylbenzamid	230
4-2	3-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-propylbenzamid	
4-3	N-Isopropyl-4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-4	N-Isopropyl-4-(2-methylthiopyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-5	N-Isopropyl-4-(2-methylpyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-6	N-Isopropyl-4-(4-trifluormethylpyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	230
4-7	N-Cyclopropyl-4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-8	N-Cyclopropyl-3-nitro-4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-9	N-Cyclopropyl-4-(2-methylthiopyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-10	N-Cyclopropyl-4-(2-methylpyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-11	N-Cyclopropyl-4-(4-trifluormethylpyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	

4-12	N-Cyclopropyl-4-(2-chlor-6-methylpyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-13	N-(1,2-Dimethylpropyl)-4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	206
4-14	4-(2-Methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-(2-phenylethyl)-benzamid	
4-15	2,4-Dichlor-N-cyclopropyl-5-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	224
4-16	4-Chlor-N-cyclopropyl-3-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	185
4-17	N-cyclopropyl-3-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-18	N-cyclopropyl-2-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-19	4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-methylbenzamid	
4-20	N-Ethyl-4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-21	2,4-Dichlor-5-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-propyl-benzamid	
4-22	4-Chlor-3-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-propyl-benzamid	
4-23	N,N-Dimethyl-4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-24	N-Allyl-4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-25	4-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-propargylbenzamid	

4-26	2,4-Dichlor-N-ethyl-5-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-27	4-Chlor-N-ethyl-3-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-benzamid	
4-28	2,4-Dichlor-5-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-methyl-benzamid	
4-29	4-Chlor-3-(2-methoxypyridin-3-ylcarbonylsulfamoyl)-N-methyl-benzamid	

## Patentansprüche

1. Gegebenenfalls mindestens ein Pestizid enthaltende  
nutzpflanzenschützende Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt mindestens  
eines Acylsulfamoylbenzoesäureamids der allgemeinen Formel I, gegebenenfalls  
auch in seiner Salzform,



in der

X CH oder N;

R<sup>1</sup> Wasserstoff, Heterocyclyl oder einen Kohlenwasserstoffrest, wobei die beiden letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO, CONH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> und Z<sup>a</sup>-R<sup>a</sup> substituiert sind;

R<sup>2</sup> Wasserstoff, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyloxy, wobei die fünf letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio substituiert sind, oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem sie tragenden Stickstoffatom einen 3- bis 8-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Ring bildend;

R<sup>3</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO, CONH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> oder Z<sup>b</sup>-R<sup>b</sup>;



- $R^4$  Wasserstoff,  $(C_1-C_4)$ -Alkyl,  $(C_2-C_4)$ -Alkenyl oder  $(C_2-C_4)$ -Alkynyl;
- $R^5$  Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, Phosphoryl, CHO, CONH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> oder  $Z^c-R^c$ ;
- $R^a$  einen  $(C_2-C_{20})$ -Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, Heterocyclyl oder einen Kohlenwasserstoffrest, wobei die zwei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ -alkyl]-amino substituiert sind;
- $R^b$ ,  $R^c$  unabhängig voneinander einen  $(C_2-C_{20})$ -Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, Heterocyclyl oder einen Kohlenwasserstoffrest, wobei die zwei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Phosphoryl,  $(C_1-C_4)$ -Haloalkoxy, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ -alkyl]-amino substituiert sind;
- $Z^a$  eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup>, C(O)NR<sup>d</sup> oder SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup>;
- $Z^b$ ,  $Z^c$  unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup> oder C(O)NR<sup>d</sup>;
- $R^d$  Wasserstoff,  $(C_1-C_4)$ -Alkyl oder  $(C_1-C_4)$ -Haloalkyl;
- n eine ganze Zahl von 0 bis 4
- und
- m für den Fall, daß X für CH steht, eine ganze Zahl von 0 bis 5, und für den Fall, daß X für N steht, eine ganze Zahl von 0 bis 4
- bedeuten.

2. Nutzpflanzenschützende Mittel nach Anspruch 1, worin

- $R^1$  Wasserstoff, 3- bis 8-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel,  $(C_1-C_{12})$ -Alkyl,  $(C_2-C_8)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_8)$ -Alkynyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkenyl oder Aryl, wobei die sieben letztgenannten Reste gegebenenfalls

durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO, CONH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> und Z<sup>a</sup>-R<sup>a</sup> substituiert sind;

R<sup>5</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, CHO, CONH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> oder Z<sup>c</sup>-R<sup>c</sup>;

R<sup>a</sup> einen (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sieben letztgenannten Reste unabhängig voneinander gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Mono- und Di-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl]-amino substituiert sind;

R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> unabhängig voneinander einen (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-Alkylrest, dessen Kohlenstoffkette ein- oder mehrfach durch Sauerstoffatome unterbrochen ist, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkynyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei die sieben letztgenannten Reste unabhängig voneinander gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Phosphoryl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkoxy, Mono- und Di-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl]-amino substituiert sind;

Z<sup>a</sup> eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup> oder C(O)NR<sup>d</sup>;

Z<sup>b</sup>, Z<sup>c</sup> unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Einheit aus der Gruppe O, S, CO, CS, C(O)O, C(O)S, SO, SO<sub>2</sub>, NR<sup>d</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup> oder C(O)NR<sup>d</sup> und

R<sup>d</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl bedeuten.

3. Nutzpflanzenschützende Mittel nach Anspruch 1 oder 2, worin

$R^1$  Wasserstoff,  $(C_1-C_8)$ -Alkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkynyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sieben letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, Cyano,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy,  $(C_1-C_6)$ -Alkylthio,  $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfonyl,  $(C_2-C_4)$ -Alkenyloxy,  $(C_2-C_4)$ -Alkenylthio,  $(C_2-C_4)$ -Alkinyloxy,  $(C_2-C_4)$ -Alkynylthio,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkoxy,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyloxy, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ -alkyl]-amino,  $[(C_1-C_6)$ -Alkoxy]-carbonyl,  $[(C_1-C_6)$ -Alkylthio]-carbonyl,  $[(C_1-C_6)$ -Alkyl]-carbonyl, Phenyl, Phenyl- $(C_1-C_4)$ -alkoxy, 5- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel und im Falle cyclischer Reste auch  $(C_1-C_4)$ -Alkyl substituiert sind, wobei die zwanzig letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen und Cyano und im Falle cyclischer Reste auch  $(C_1-C_4)$ -Alkyl substituiert sind;

$R^3$ ,  $R^5$  unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Amino, Hydroxy, Cyano,  $SO_2NH_2$ ,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkynyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyloxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyloxy, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ -Alkyl]-aminosulfonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylthio,  $(C_1-C_8)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxycarbonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylthiocarbonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylcarbonyl, wobei die fünfzehn letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen,  $(C_1-C_4)$ -Haloalkoxy, Cyano,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy und im Falle cyclischer Reste auch  $(C_1-C_4)$ -Alkyl und  $(C_1-C_4)$ -Haloalkyl substituiert sind, bedeuten.

4. Nutzpflanzenschützende Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 3, worin

X CH,

$R^1$  Wasserstoff,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_3-C_6)$ -Cycloalkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_5-C_6)$ -Cycloalkenyl, Phenyl oder 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl mit bis zu drei Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei die sechs

letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylcarbonyl und Phenyl und im Falle cyclischer Reste auch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl substituiert sind;

R<sup>2</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, wobei die drei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, Hydroxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio substituiert sind;

R<sup>3</sup> Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkoxy, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxycarbonyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylcarbonyl;

R<sup>4</sup> Wasserstoff;

R<sup>5</sup> Halogen, Nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, Phenyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, Cyano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxycarbonyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylcarbonyl;

n 0, 1 oder 2 und

m 1 oder 2

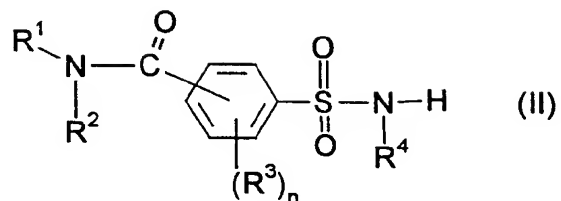
bedeuten.

5. Nutzpflanzenschützende Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 4, worin

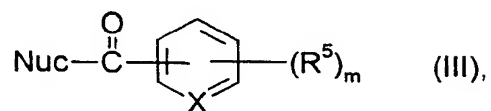
R<sup>1</sup> Wasserstoff, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkyl, wobei die zwei letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere, gleiche oder verschiedene Substituenten aus der Gruppe Halogen, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxy und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylthio und im Falle cyclischer Reste auch (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl und (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Haloalkyl substituiert sind, bedeutet.

6. Nutzpflanzenschützende Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 5, worin sich die Sulfamoylgruppe in 4-Position des Phenylringes befindet.

7. Nutzpflanzenschützende Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 6, enthaltend mindestens ein Herbizid.
8. Nutzpflanzenschützende Mittel nach einem der Ansprüche 1 bis 7, enthaltend mindestens ein Herbizid aus den Gruppen
- A) Phenoxyphenoxy- und Heteroaryloxyphenoxycarbonsäurederivate
  - B) Sulfonylharnstoffe
  - C) Chloracetanilide
  - D) Thiocarbamate
  - E) Cyclohexandionoxime
  - F) Imidazolinone
  - G) Triazolopyrimidinsulfonamidderivate
  - H) Benzoylcyclohexandione
  - I) Pyrimidinyloxy-pyridincarbonsäure- bzw. Pyrimidinyloxybenzoesäure-derivate
  - J) S-(N-Aryl-N-alkyl-carbamoylmethyl)-dithiophosphonsäureester
9. Verfahren zum Schutz von Nutzpflanzen vor den phytotoxischen Eigenschaften von Pestiziden, dadurch gekennzeichnet, daß Mittel gemäß einem der Ansprüche 1 bis 8 in einer Nutzpflanzenkultur verwendet werden.
10. Acylsulfamoylbenzoesäureamide der allgemeinen Formel I nach einem der Ansprüche 1 bis 5, mit der Maßgabe, daß
- a)  $R^5$  in der Bedeutung von  $COOR^c$  oder  $CONR^d$  nicht direkt benachbart zu X gebunden ist, wenn X für N steht
  - b)  $R^1$  nicht Phenyl, Benzyl oder 4-Carboxyphenyl bedeutet, wenn X für CH und  $R^2$ ,  $R^4$  und  $R^5$  jeweils für Wasserstoff stehen.
11. Verfahren zur Herstellung von Acylsulfamoylbenzoesäureamiden nach Anspruch 10, dadurch gekennzeichnet, daß
- a) eine Verbindung der allgemeinen Formel II



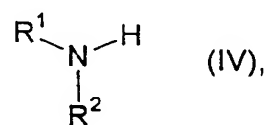
mit einem Acylierungsmittel der allgemeinen Formel III



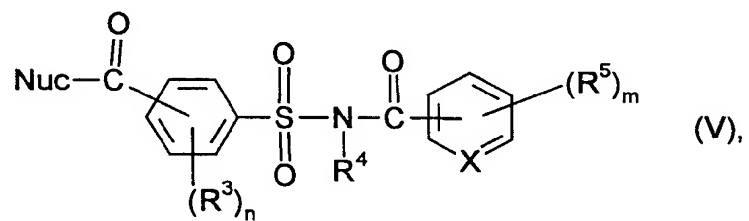
worin Nuc eine Abgangsgruppe ist, umgesetzt, oder die Carbonsäure direkt unter Verwendung von Kupplungsreagenzien, wie Dicyclohexylcarbodiimid, mit dem Sulfonamid der Formel II umgesetzt,

oder

b) eine Verbindung der allgemeinen Formel IV



mit aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen Formel V



worin Nuc eine Abgangsgruppe bedeutet, umgesetzt.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 98/06097

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07C311/51 C07D213/81 A01N37/28 A01N43/40

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07C C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 567 997 A (HOECHST) 3 November 1993 see page 2, line 29 - page 3, line 51; examples 125,309-319 ---	10
X	WO 96 10559 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL) 11 April 1996 see page 41, line 21 - page 42, line 6 ---	10
A	DE 196 21 522 A (HOECHST SCHERING AGREVO) 4 December 1997 see page 2 - page 3 ---	1-11
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 009, no. 134 (C-285), 8 June 1985 & JP 60 019761 A (MEIJI SEIKA KK), 31 January 1985 see abstract --- -/--	1, 10



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

10 February 1999

Date of mailing of the international search report

25/02/1999

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

English, R



## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 98/06097

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 84, no. 3, 19 January 1976 Columbus, Ohio, US; abstract no. 17204b, T. TOKUMITSU, ET AL.: "Reaction of alpha,beta-unsaturated beta-amino ketones with thiocyanogen" XP002092978 cited in the application see abstract -&amp; CHEMICAL ABSTRACTS, 9TH COLLECTIVE CHEMICAL SUBSTANCES INDEX, page 2905 XP002092976 -&amp; CHEMICAL ABSTRACTS, 9TH COLLECTIVE CHEMICAL SUBSTANCES INDEX, page 6364 XP002092977 &amp; NIPPON KAGAKU KAISHI, no. 1, 1975, pages 123-126, see CAS RN 54972-81-5, 54972-82-6, 54972-83-7</p> <p>---</p>	10
A	<p>EP 0 562 512 A (HOECHST) 29 September 1993 cited in the application see page 2, line 28 - page 3, column 55; examples</p> <p>---</p>	1,10
A	<p>EP 0 590 520 A (HOECHST) 6 April 1994 cited in the application see page 2, line 28 - page 8, line 7; examples</p> <p>---</p>	1,10
A	<p>EP 0 673 932 A (HOECHST) 27 September 1995 cited in the application see page 2, line 35 - page 3, line 45; examples</p> <p>-----</p>	1,10

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 98/06097

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0567997	A	03-11-1993	AU 3822593 A	04-11-1993
			CA 2095206 A	31-10-1993
			CN 1079466 A	15-12-1993
			CZ 9300780 A	19-01-1994
			FI 931907 A	31-10-1993
			HU 9500066 A	28-04-1995
			JP 6087831 A	29-03-1994
			PL 298749 A	13-12-1993
			ZA 9302983 A	15-11-1993
WO 9610559	A	11-04-1996	AU 3577995 A	26-04-1996
			CA 2200981 A	11-04-1996
			EP 0784612 A	23-07-1997
			JP 10510512 T	13-10-1998
			ZA 9508365 A	08-05-1996
DE 19621522	A	04-12-1997	AU 2892197 A	05-01-1998
			WO 9745016 A	04-12-1997
EP 0562512	A	29-09-1993	AU 3536993 A	30-09-1993
			CA 2092276 A	25-09-1993
			CN 1076691 A	29-09-1993
			CZ 9300463 A	19-01-1994
			FI 931250 A	25-09-1993
			HU 69685 A	28-09-1995
			HU 9500068 A	28-04-1995
			JP 6049030 A	22-02-1994
			NO 179867 B	23-09-1996
			NZ 247201 A	28-05-1996
			PL 298195 A	10-01-1994
			SK 22393 A	06-10-1993
			US 5607954 A	04-03-1997
			ZA 9302047 A	19-10-1993
EP 0590520	A	06-04-1994	DE 4233124 A	07-04-1994
			AT 139227 T	15-06-1996
			AU 662448 B	31-08-1995
			AU 4872693 A	14-04-1994
			CA 2107514 A	03-04-1994
			CN 1089603 A	20-07-1994
			CZ 9302044 A	18-05-1994
			DE 59302898 D	18-07-1996
			DK 590520 T	14-10-1996
			ES 2090806 T	16-10-1996
			FI 934303 A	03-04-1994
			GR 3020230 T	30-09-1996
			HU 67292 A	28-03-1995
			JP 6211795 A	02-08-1994
			NO 933521 A, B,	05-04-1994
			NZ 248819 A	27-02-1996
			PL 300561 A	05-04-1994
			US 5428046 A	27-06-1995
			ZA 9307298 A	25-04-1994
EP 0673932	A	27-09-1995	DE 4410480 A	28-09-1995
			AU 688450 B	12-03-1998
			AU 1504395 A	05-10-1995
			CA 2145475 A	26-09-1995

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

International Application No

PCT/EP 98/06097

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0673932 A		CZ 9500734 A	15-11-1995
		FI 951387 A	26-09-1995
		HU 72598 A	28-05-1996
		JP 7278110 A	24-10-1995
		NO 951149 A	26-09-1995
		NZ 270784 A	24-02-1997
		PL 307847 A	02-10-1995
		US 5620996 A	15-04-1997
		ZA 9502409 A	28-11-1995
<hr/>			

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/06097

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> IPK 6 C07C311/51 C07D213/81 A01N37/28 A01N43/40		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b>		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 6 C07C C07D A01N		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie <sup>o</sup>	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 567 997 A (HOECHST) 3. November 1993 siehe Seite 2, Zeile 29 - Seite 3, Zeile 51; Beispiele 125,309-319 ---	10
X	WO 96 10559 A (FUJISAWA PHARMACEUTICAL) 11. April 1996 siehe Seite 41, Zeile 21 - Seite 42, Zeile 6 ---	10
A	DE 196 21 522 A (HOECHST SCHERING AGREVO) 4. Dezember 1997 siehe Seite 2 - Seite 3 ---	1-11
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 009, no. 134 (C-285), 8. Juni 1985 & JP 60 019761 A (MEIJI SEIKA KK), 31. Januar 1985 siehe Zusammenfassung ---	1,10
-/-		
<div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <span><input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen</span> <span><input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie</span> </div>		
<div style="display: flex;"> <div style="flex: 1;"> <p><sup>o</sup> Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :</p> <p>"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</p> <p>"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)</p> <p>"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</p> <p>"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</p> </div> <div style="flex: 1;"> <p>"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</p> <p>"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</p> <p>"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist</p> <p>"&amp;" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</p> </div> </div>		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
10. Februar 1999		25/02/1999
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2230 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter  English, R

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	<p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 84, no. 3, 19. Januar 1976 Columbus, Ohio, US; abstract no. 17204b, T. TOKUMITSU, ET AL.: "Reaction of alpha,beta-unsaturated beta-amino ketones with thiocyanogen" XP002092978 in der Anmeldung erwähnt siehe Zusammenfassung -&amp; CHEMICAL ABSTRACTS, 9TH COLLECTIVE CHEMICAL SUBSTANCES INDEX, Seite 2905 XP002092976 -&amp; CHEMICAL ABSTRACTS, 9TH COLLECTIVE CHEMICAL SUBSTANCES INDEX, Seite 6364 XP002092977 &amp; NIPPON KAGAKU KAISHI, Nr. 1, 1975, Seiten 123-126, siehe CAS RN 54972-81-5, 54972-82-6, 54972-83-7</p> <p>----</p>	10
A	<p>EP 0 562 512 A (HOECHST) 29. September 1993 in der Anmeldung erwähnt siehe Seite 2, Zeile 28 - Seite 3, Spalte 55; Beispiele</p> <p>----</p>	1,10
A	<p>EP 0 590 520 A (HOECHST) 6. April 1994 in der Anmeldung erwähnt siehe Seite 2, Zeile 28 - Seite 8, Zeile 7; Beispiele</p> <p>----</p>	1,10
A	<p>EP 0 673 932 A (HOECHST) 27. September 1995 in der Anmeldung erwähnt siehe Seite 2, Zeile 35 - Seite 3, Zeile 45; Beispiele</p> <p>-----</p>	1,10

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/06097

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0567997 A	03-11-1993	AU 3822593 A	04-11-1993
		CA 2095206 A	31-10-1993
		CN 1079466 A	15-12-1993
		CZ 9300780 A	19-01-1994
		FI 931907 A	31-10-1993
		HU 9500066 A	28-04-1995
		JP 6087831 A	29-03-1994
		PL 298749 A	13-12-1993
		ZA 9302983 A	15-11-1993
WO 9610559 A	11-04-1996	AU 3577995 A	26-04-1996
		CA 2200981 A	11-04-1996
		EP 0784612 A	23-07-1997
		JP 10510512 T	13-10-1998
		ZA 9508365 A	08-05-1996
DE 19621522 A	04-12-1997	AU 2892197 A	05-01-1998
		WO 9745016 A	04-12-1997
EP 0562512 A	29-09-1993	AU 3536993 A	30-09-1993
		CA 2092276 A	25-09-1993
		CN 1076691 A	29-09-1993
		CZ 9300463 A	19-01-1994
		FI 931250 A	25-09-1993
		HU 69685 A	28-09-1995
		HU 9500068 A	28-04-1995
		JP 6049030 A	22-02-1994
		NO 179867 B	23-09-1996
		NZ 247201 A	28-05-1996
		PL 298195 A	10-01-1994
		SK 22393 A	06-10-1993
		US 5607954 A	04-03-1997
		ZA 9302047 A	19-10-1993
EP 0590520 A	06-04-1994	DE 4233124 A	07-04-1994
		AT 139227 T	15-06-1996
		AU 662448 B	31-08-1995
		AU 4872693 A	14-04-1994
		CA 2107514 A	03-04-1994
		CN 1089603 A	20-07-1994
		CZ 9302044 A	18-05-1994
		DE 59302898 D	18-07-1996
		DK 590520 T	14-10-1996
		ES 2090806 T	16-10-1996
		FI 934303 A	03-04-1994
		GR 3020230 T	30-09-1996
		HU 67292 A	28-03-1995
		JP 6211795 A	02-08-1994
		NO 933521 A, B,	05-04-1994
		NZ 248819 A	27-02-1996
		PL 300561 A	05-04-1994
		US 5428046 A	27-06-1995
		ZA 9307298 A	25-04-1994
EP 0673932 A	27-09-1995	DE 4410480 A	28-09-1995
		AU 688450 B	12-03-1998
		AU 1504395 A	05-10-1995
		CA 2145475 A	26-09-1995

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 98/06097

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0673932 A		CZ 9500734 A	15-11-1995
		FI 951387 A	26-09-1995
		HU 72598 A	28-05-1996
		JP 7278110 A	24-10-1995
		NO 951149 A	26-09-1995
		NZ 270784 A	24-02-1997
		PL 307847 A	02-10-1995
		US 5620996 A	15-04-1997
		ZA 9502409 A	28-11-1995
<hr/>			